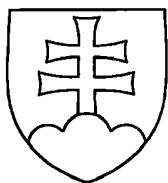


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19) SK



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

ZVEREJNENÁ PATENTOVÁ PRIHLÁŠKA

- (22) Dátum podania prihlášky: 2. 12. 1999
(31) Číslo prioritnej prihlášky: 198 55 850.3
199 36 705.1
(32) Dátum podania prioritnej prihlášky: 4. 12. 1998
6. 8. 1999
(33) Krajina alebo regionálna
organizácia priority: DE, DE
(40) Dátum zverejnenia prihlášky: 3. 12. 2001
Vestník ÚPV SR č.: 12/2001
(62) Číslo pôvodnej prihlášky
v prípade vylúčenej prihlášky:
(86) Číslo podania medzinárodnej prihlášky
podľa PCT: PCT/EP99/09412
(87) Číslo zverejnenia medzinárodnej prihlášky
podľa PCT: WO00/34272

(11), (21) Číslo dokumentu:

748-2001

(13) Druh dokumentu: A3

(51) Int. Cl. 7 :

C07D413/10,
C07D231/20,
A01N 43/74,
A01N 43/50

(71) Prihlasovateľ: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, Ludwigshafen, DE;

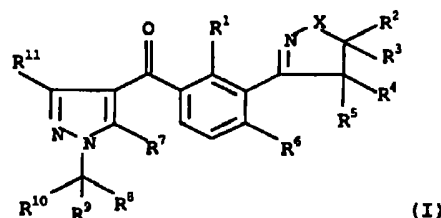
(72) Pôvodca: Neidlein Ulf, Mannheim, DE;
Götz Norbert, Worms, DE;
Misslitz Ulf, Neustadt, DE;
Götz Roland, Neulussheim, DE;
Baumann Ernst, Dudenhofen, DE;
Von Deyn Wolfgang, Neustadt, DE;
Kudis Steffen, Mannheim, DE;
Langemann Klaus, Worms, DE;
Mayer Guido, Neustadt, DE;
Witschel Matthias, Ludwigshafen, DE;
Otten Martina, Ludwigshafen, DE;
Westphalen Karl-Otto, Speyer, DE;
Walter Helmut, Obrigheim, DE;

(74) Zástupca: Žovicová Viera, Mgr., Bratislava, SK;

(54) Názov 3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty

(57) Anotácia:

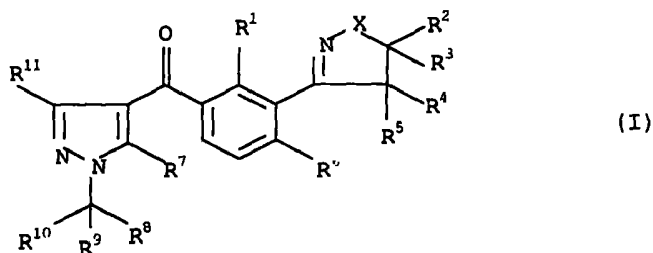
Sú opísané 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca (I), v ktorom premenné majú nasledujúce významy: X znamená O, NH alebo N-alkyl; R¹ predstavuje nitroskupinu, halogén,alkoxyskupinu, halogénalkoxyskupinu, alkyltioskupinu, halogénalkyltioskupinu, alkylsulfonylovú skupinu alebo halogénalkyl-sulfonylovú skupinu; R², R³, R⁴, R⁵ znamenajú vodík, alkylovú skupinu alebo halogénalkylovú skupinu; R⁶ predstavuje halogén, nitroskupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxylovú skupinu, halogénalkoxylovú skupinu, alkyltioskupinu, halogénalkyltioskupinu, alkylsulfonylovú skupinu alebo halogénalkylsulfonylovú skupinu; R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, alkoxylovú skupinu, alkenyloxylovú skupinu, alkylsulfonyloxylovú skupinu, alkylkarbonyloxylovú skupinu, (alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok môže byť substituovaný; R⁸, R⁹ znamenajú alkylovú skupinu; R¹⁰ predstavuje vodík alebo alkylovú skupinu; a R¹¹ znamená vodík alebo alkylovú skupinu; a ich poľnohospodársky využiteľných solí. Tiež je opísaný spôsob prípravy týchto zlúčenín a použitie prípravkov, ktoré ich obsahujú, na ničenie škodlivých rastlín.



3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty

Podstata vynálezu

Predložený vynález sa týka 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátov všeobecného vzorca I



v ktorom:

X znamená O, NH alebo N(C₁-C₆-alkyl);

R¹ predstavuje nitroskupinu, halogén, C₁-C₄-alkoxylovú skupinu, C₁-C₄-halogénalkoxylovú skupinu, C₁-C₄-alkyltioskupinu, C₁-C₄-halogénalkyltioskupinu, C₁-C₄-alkylsulfonylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkylsulfonylovú skupinu;

R², R³, R⁴, R⁵ znamenajú vodík, C₁-C₄-alkylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkylovú skupinu;

R⁶ predstavuje halogén, nitroskupinu, C₁-C₄-halogénalkylovú skupinu, C₁-C₄-alkoxylovú skupinu, C₁-C₄-halogénalkoxylovú skupinu, C₁-C₄-alkyltioskupinu, C₁-C₄-halogénalkyltioskupinu, C₁-C₄-alkylsulfonylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkylsulfonylovú skupinu;

R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, C₁-C₆-alkoxylovú skupinu, C₃-C₆-alkenyloxylovú skupinu, C₁-C₆-alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁-C₆-alkylkarbonyloxylovú skupinu, C₁-C₄-(alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, kde fenylový zvyšok posledných dvoch uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri

z nasledujúcich skupín, ako je nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina;

R⁸, R⁹ znamenajú C₁–C₄–alkylovú skupinu;

R¹⁰ predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; kde počet atómov uhlíka vo zvyškoch R⁸, R⁹ a R¹⁰ spoločne predstavuje najviac 7,

R¹¹ znamená vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu;

a ich poľnohospodársky využiteľných solí.

Okrem toho sa vynález týka spôsobov prípravy zlúčenín všeobecného vzorca I, kompozícií, ktoré ich obsahujú a použitia týchto derivátov alebo kompozícií, ktoré ich obsahujú, na ničenie škodlivých rastlín.

Pyrazol-4-yl-benzoylové deriváty sú opísané v literatúre, napríklad v dokumentoch WO 96/26206 a WO 98/31681.

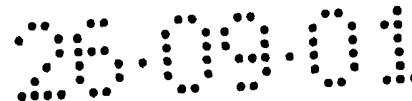
Avšak, herbicídne vlastnosti zlúčenín z doterajšieho stavu techniky a ich kompatibilita s poľnohospodárskymi plodinami nie sú dostatočne uspokojivé.

Predmetom predloženého vynálezu je poskytnúť nové, predovšetkým herbicídne účinné, zlúčeniny, ktoré vykazujú zlepšené vlastnosti.

Zistili sme, že tento cieľ sa dá dosiahnuť pomocou 3–(heterocyklyl)-benzoylpyrazolových derivátov vzorca I a ich herbicídneho účinku.

Okrem toho sme našli herbicídne kompozície, ktoré obsahujú zlúčeniny vzorca I a vykazujú veľmi dobrý herbicídny účinok. Taktiež sme našli spôsoby na prípravu týchto kompozícií a spôsoby ničenia nežiadúcej vegetácie s použitím zlúčenín vzorca I.

V závislosti od substitučného vzoru, zlúčeniny vzorca I môžu obsahovať jedno alebo viac chirálnych centier, pričom v takomto prípade sú prítomné ako



enantioméry alebo zmesi diastereoizomérov. Vynález poskytuje ako čisté enantioméry tak aj diastereoizoméry a ich zmesi.

Zlúčeniny vzorca I môžu byť tiež prítomné vo forme svojich poľnohospodársky využiteľných solí, pričom druh soli zvyčajne nie je podstatný. Vo všeobecnosti sú vhodné soli takých kationov alebo kyslé adičné soli takých kyselín, ktorých kationy a anióny nepriaznivo neovplyvňujú herbicídny účinok zlúčenín vzorca I.

Vhodnými kationmi sú predovšetkým ióny alkalických kovov, výhodne lítium, sodík a draslík, kovov alkalických zemín, výhodne vápnik a horčík, a prechodných kovov, výhodne mangán, meď, zinok a železo, a tiež amóniové soli, pričom, ak je to potrebné, jeden až štyri atómy vodíka tu môžu byť nahradené substituentom, ako je C_1-C_4 -alkylová skupina, hydroxy- C_1-C_4 -alkylová skupina, C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkylová skupina, hydroxy- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkylová skupina, fenyl alebo benzyl, výhodne amónium, dimetylamónium, diizopropylamónium, tetrametylamónium, tetrabutylamónium, 2-(2-hydroxyet-1-oxy)et-1-ylamónium, di(2-hydroxyet-1-yl)-amónium, trimetylbenzylamónium, okrem toho tiež fosfóniové ióny, sulfóniové ióny, výhodne tri(C_1-C_4 -alkyl)sulfónium, a sulfoxóniové ióny, výhodne tri(C_1-C_4 -alkyl)-sulfoxónium.

Aniónmi využiteľných kyslých adičných solí sú predovšetkým chlorid, bromid, fluorid, hydrogensíran, síran, dihydrogenfosforečnan, hydrogenfosforečnan, dusičnan, hydrogenuhličitan, uhličitan, hexafluórkremičitan, hexafluórfosforečnan, benzoát a anióny C_1-C_4 -alkánových kyselín, výhodne mravčan, octan, propionát a butyrát.

Organické molekulové časti uvedené pre substituenty R^1 až R^{11} alebo ako zvyšky na fenylových kruhoch sú súbornými termínmi pre jednotlivé špecifikácie jednotlivých členov skupiny. Všetky uhľovodíkové reťazce, t.j. všetky alkylové, alkylkarbonylové, halogénalkylové, alkoxylové, halogénalkoxylové, alkylkarbonyloxylové, (alkyltio)karbonyloxylové, alkylsulfonyloxylové, alkyltio, halogénalkyltio, alkylsulfonylové, halogénalkylsulfonylové, alkenylové a alkenyloxylové časti môžu byť lineárny reťazec alebo byť rozvetvené. Pokým nie je uvedené inak,

halogénované substituenty výhodne nesú jeden až päť rovnakých alebo rozdielnych atómov halogénu. Termín „halogén“ predstavuje v každom prípade fluór, chlór, bróm alebo jód.

Príkladmi ďalších významov sú:

- C_1 – C_4 –alkylová skupina a alkylové časti C_1 – C_4 –alkylkarbonylovej skupiny a C_1 – C_4 –alkylkarbonyloxylovej skupiny: napríklad metyl, etyl, propyl, 1–metyletyl, butyl, 1–metylpropyl, 2–metylpropyl a 1,1–dimetyletyl;
- C_1 – C_6 –alkylová skupina a alkylové časti C_1 – C_6 –alkylkarbonylovej skupiny a C_1 – C_6 –alkylkarbonyloxylovej skupiny: C_1 – C_4 –alkylová skupina, ako je uvedené vyššie, a tiež napríklad, pentyl, 1–metylbutyl, 2–metylbutyl, 3–metylbutyl, 2,2–dimetylpropyl, 1–etylpropyl, hexyl, 1,1–dimetylpropyl, 1,2–dimetylpropyl, 1–metylpentyl, 2–metylpentyl, 3–metylpentyl, 4–metylpentyl, 1,1–dimetylbutyl, 1,2–dimetylbutyl, 1,3–dimetylbutyl, 2,2–dimetylbutyl, 2,3–dimetylbutyl, 3,3–dimetylbutyl, 1–etylbutyl, 2–etylbutyl, 1,1,2–trimetylpropyl, 1–etyl–1–metylpropyl a 1–etyl–3–metylpropyl;
- C_1 – C_4 –halogénalkylová skupina: C_1 – C_4 –alkylový zvyšok, ako je uvedené vyššie, ktorý je čiastočne alebo úplne substituovaný fluórom, chlórom, brómom a/alebo jódom, t.j. napríklad, chlórmetyl, dichlórmetyl, trichlórmetyl, fluórmetyl, difluórmetyl, trifluórmetyl, chlórfluórmetyl, dichlórfluórmetyl, chlórdifluórmetyl, brómmetyl, jódmetyl, 1–fluóretyl, 1–chlóretyl, 1–brómetyl, 1–jódetyl, 2–fluóretyl, 2–chlóretyl, 2–brómetyl, 2–jódetyl, 2,2–difluóretyl, 2,2,2–trifluóretyl, 2–chlór-2–fluóretyl, 2–chlór-2,2–difluóretyl, 2,2–dichlór-2–fluóretyl, 2,2,2–trichlóretyl, pentafluóretyl, 2–fluórpropyl, 3–fluórpropyl, 2,2–difluórpropyl, 2,3–difluórpropyl, 2–chlórpropyl, 3–chlórpropyl, 2,3–dichlórpropyl, 2–brómpropyl, 3–brómpropyl, 3,3,3–trifluórpropyl, 3,3,3–trichlórpropyl, 2,2,3,3,3–pentafluórpropyl, heptafluórpropyl, 1–(fluórmetyl)–2–fluóretyl, 1–(chlórmetyl)–2–chlóretyl, 1–

(brómmetyl)-2-brómmetyl, 4-fluórbutyl, 4-chlórbutyl, 4-brómbutyl a nonafluórbutyl;

- C₁-C₄-alkoxylová skupina: napríklad metoxy, etoxy, propoxy, 1-metyletoxy, butoxy, 1-metylpropoxy, 2-metylpropoxy a 1,1-dimetyletoxy;
- C₁-C₆-alkoxylová skupina: C₁-C₄-alkoxylová skupina, ako je uvedené vyššie, a tiež napríklad, pentoxy, 1-metylbutoxy, 2-metylbutoxy, 3-metylbutoxy, 1,1-dimetylpropoxy, 1,2-dimetylpropoxy, 2,2-dimetylpropoxy, 1-etylpropoxy, hexoxy, 1-metylpentoxy, 2-metylpentoxy, 3-metylpentoxy, 4-metylpentoxy, 1,1-dimetylbutoxy, 1,2-dimetylbutoxy, 1,3-dimetylbutoxy, 2,2-dimetylbutoxy, 2,3-dimetylbutoxy, 3,3-dimetylbutoxy, 1-etylbutoxy, 2-etylbutoxy, 1,1,2-trimetylpropoxy, 1,2,2-trimetylpropoxy, 1-etyl-1-metylpropoxy a 1-etyl-2-metylpropoxy;
- C₁-C₄-halogénalkoxylová skupina: C₁-C₄-alkoxylový zvyšok, ako je uvedené vyššie, ktorý je čiastočne alebo úplne substituovaný fluórom, chlórrom, brómom a/alebo jódom, t.j. napríklad, fluórmetoxy, difluórmetoxy, trifluórmetoxy, chlórdifluórmetoxy, brómdifluórmetoxy, 2-fluóretoxy, 2-chlóretoxy, 2-brómmetoxy, 2-jódetoxy, 2,2-difluóretoxy, 2,2,2-trifluóretoxy, 2-chlór-2-fluóretoxy, 2-chlór-2,2-difluóretoxy, 2,2-dichlór-2-fluóretoxy, 2,2,2-trichlóretoxy, pentafluóretoxy, 2-fluórpropoxy, 3-fluórpropoxy, 2-chlórpropoxy, 3-chlórpropoxy, 2-brómpropoxy, 3-brómpropoxy, 2,2-difluórpropoxy, 2,3-difluórpropoxy, 2,3-dichlórpropoxy, 3,3,3-trifluórpropoxy, 3,3,3-trichlórpropoxy, 2,2,3,3,3-pentafluórpropoxy, heptafluórpropoxy, 1-(fluórmetyl)-2-fluóretoxy, 1-(chlórmetyl)-2-chlóretoxy, 1-(brómmetyl)-2-brómetoxy, 4-fluórbutoxy, 4-chlórbutoxy, 4-brómbutoxy a nonafluórbutoxy;
- C₁-C₄-alkyltioskupina a alkyltiolové časti C₁-C₄-(alkyltio)-karbonylovej skupiny: napríklad metyltio, etyltio, propyltio, 1-metyletyltio, butyltio, 1-metylpropyltio, 2-metylpropyltio a 1,1-dimetyletyltio;

- **C₁–C₄–halogénalkyltioskupina:** C₁–C₄–alkyltiolový zvyšok, ako je uvedené vyššie, ktorý je čiastočne alebo úplne substituovaný fluórom, chlórrom, brómom a/alebo jódom, t.j. napríklad fluórmetyltio, difluórmetyltio, trifluórmetyltio, chlórdifluórmetyltio, brómdifluórmetyltio, 2–fluóretylio, 2–chlóretylio, 2–brómetylio, 2–jódetylio, 2,2–difluóretylio, 2,2,2–trifluóretylio, 2,2,2–trichlóretylio, 2–chlór–2–fluóretylio, 2–chlór–2,2–difluóretylio, 2,2–dichlór–2–fluóretylio, pentafluóretylio, 2–fluórpropylio, 3–fluóropropylio, 2–chlórpropylio, 3–chlórpropylio, 2–brómpropylio, 3–brómpropylio, 2,2–difluórpropylio, 2,3–difluórpropylio, 2,3–dichlórpropylio, 3,3,3–trifluórpropylio, 3,3,3–trichlórpropylio, 2,2,3,3,3–pentafluórpropylio, heptafluórpropylio, 1–(fluórmetyl)–2–fluóretylio, 1–(chlórmetyl)–2–chlóretylio, 1–(brómmetyl)–2–brómetylio, 4–fluórbutylio, 4–chlórbutylio, 4–brómbutylio a nonafluórbutylio;
- **C₁–C₄–alkylsulfonylová skupina** (C₁–C₄–alkyl–S(=O)₂–), a alkylsulfonylové časti C₁–C₄–alkylsulfonyloxylovej skupiny: napríklad metylsulfonyl, etylsulfonyl, propylsulfonyl, 1–metyletylsulfonyl, butylsulfonyl, 1–metylpropylsulfonyl, 2–metylpropylsulfonyl a 1,1–dimetyletylsulfonyl;
- **C₁–C₆–alkylsulfonylová skupina**, a alkylsulfonylové časti C₁–C₆–alkylsulfonyloxylovej skupiny: C₁–C₄–alkylsulfonylový zvyšok, ako je uvedené vyššie, a tiež napríklad, pentylsulfonyl, 1–metylbutylsulfonyl, 2–metylbutylsulfonyl, 3–metylbutylsulfonyl, 1,1–dimetylpropylsulfonyl, 1,2–dimetylpropylsulfonyl, 2,2–dimetylpropylsulfonyl, 1–etylpropylsulfonyl, hexylsulfonyl, 1–metylpentylsulfonyl, 2–metylpentylsulfonyl, 3–metylpentylsulfonyl, 4–metylpentylsulfonyl, 1,1–dimetylbutylsulfonyl, 1,2–dimetylbutylsulfonyl, 1,3–dimetylbutylsulfonyl, 2,2–dimetylbutylsulfonyl, 2,3–dimetylbutylsulfonyl, 3,3–dimetylbutylsulfonyl, 1–etylbutylsulfonyl, 2–etylbutylsulfonyl, 1,1,2–trimetylpropylsulfonyl, 1,2,2–trimetylpropylsulfonyl, 1–etyl–1–metylpropylsulfonyl a 1–etyl–2–metylpropylsulfonyl;

- **C₁–C₄–halogénalkylsulfonylová skupina:** C₁–C₄–alkylsulfonylový zvyšok, ako je uvedené vyššie, ktorý je čiastočne alebo úplne substituovaný fluórom, chlór, brómom a/alebo jódom, t.j. napríklad, fluórmetylsulfonyl, difluórmetylsulfonyl, trifluórmetylsulfonyl, chlór-difluórmetylsulfonyl, brómdifluórmetylsulfonyl, 2–fluóretylsulfonyl, 2–chlóretylsulfonyl, 2–brómetylsulfonyl, 2–jódetylsulfonyl, 2,2–difluór-etyl-sulfonyl, 2,2,2–trifluóretylsulfonyl, 2–chlór–2–fluóretylsulfonyl, 2–chlór–2,2–difluóretyl-sulfonyl, 2,2–dichlór–2–fluóretylsulfonyl, 2,2,2–trichlóretylsulfonyl, pentafluór-etyl-sulfonyl, 2–fluórpropylsulfonyl, 3–fluórpropylsulfonyl, 2–chlórpropylsulfonyl, 3–chlórpropylsulfonyl, 2–brómpropylsulfonyl, 3–brómpropylsulfonyl, 2,2–difluórpropylsulfonyl, 2,3–difluórpropylsulfonyl, 2,3–dichlórpropylsulfonyl, 3,3,3–trifluór-propylsulfonyl, 3,3,3–trichlórpropyl-sulfonyl, 2,2,3,3,3–pentafluór-propylsulfonyl, heptafluórpropylsulfonyl, 1–(fluórmetyl)–2–fluóretyl-sulfonyl, 1–(chlórmetyl)–2–chlóretylsulfonyl, 1–(brómmetyl)–2–brómetyl-sulfonyl, 4–fluórbutylsulfonyl, 4–chlórbutylsulfonyl, 4–brómbutylsulfonyl a nonafluórbutylsulfonyl;
- **C₃–C₆–alkenyloxylová skupina:** napríklad prop-1-en-1-yloxy, prop-2-en-1-yloxy, 1-metyletenyloxy, buten-1-yloxy, buten-2-yloxy, buten-3-yloxy, 1-metylprop-1-en-1-yloxy, 2-metylprop-1-en-1-yloxy, 1-metylprop-2-en-1-yloxy, 2-metylprop-2-en-1-yloxy, penten-1-yloxy, penten-2-yloxy, penten-3-yloxy, penten-4-yloxy, 1-metylbut-1-en-1-yloxy, 2-metylbut-1-en-1-yloxy, 3-metylbut-1-en-1-yloxy, 1-metylbut-2-en-1-yloxy, 2-metylbut-2-en-1-yloxy, 3-metylbut-2-en-1-yloxy, 1-metylbut-3-en-1-yloxy, 2-metylbut-3-en-1-yloxy, 3-metylbut-3-en-1-yloxy, 1,1-dimetylprop-2-en-1-yloxy, 1,2-dimetylprop-1-en-1-yloxy, 1,2-dimetylprop-2-en-1-yloxy, 1-etylprop-1-en-2-yloxy, 1-etylprop-2-en-1-yloxy, hex-1-en-1-yloxy, hex-2-en-1-yloxy, hex-3-en-1-yloxy, hex-4-en-1-yloxy, hex-5-en-1-yloxy, 1-metylpent-1-en-1-yloxy, 2-metylpent-1-en-1-yloxy, 3-metylpent-1-en-1-yloxy, 4-metylpent-1-en-1-yloxy, 1-metylpent-2-en-1-yloxy, 2-metylpent-2-en-1-yloxy, 3-metylpent-2-en-1-yloxy, 4-metylpent-2-en-1-yloxy, 1-metylpent-3-en-1-yloxy, 2-metylpent-3-en-1-yloxy, 3-metylpent-3-en-1-

yloxy, 4-metylpent-3-en-1-yloxy, 1-metylpent-4-en-1-yloxy, 2-metylpent-4-en-1-yloxy, 3-metylpent-4-en-1-yloxy, 4-metylpent-4-en-1-yloxy, 1,1-dimetylbut-2-en-1-yloxy, 1,1-dimetylbut-3-en-1-yloxy, 1,2-dimetylbut-1-en-1-yloxy, 1,2-dimetylbut-2-en-1-yloxy, 1,2-dimetylbut-3-en-1-yloxy, 1,3-dimetylbut-1-en-1-yloxy, 1,3-dimetylbut-2-en-1-yloxy, 1,3-dimetylbut-3-en-1-yloxy, 2,2-dimetylbut-3-en-1-yloxy, 2,3-dimetylbut-1-en-1-yloxy, 2,3-dimetylbut-2-en-1-yloxy, 2,3-dimetylbut-3-en-1-yloxy, 3,3-dimetylbut-1-en-1-yloxy, 3,3-dimetylbut-2-en-1-yloxy, 1-etylbut-1-en-1-yloxy, 1-etylbut-2-en-1-yloxy, 1-etylbut-3-en-1-yloxy, 2-etylbut-1-en-1-yloxy, 2-etylbut-2-en-1-yloxy, 2-etylbut-3-en-1-yloxy, 1,1,2-trimetylprop-2-en-1-yloxy, 1-etyl-1-metylprop-2-en-1-yloxy, 1-etyl-2-metylprop-1-en-1-yloxy a 1-etyl-2-metylprop-2-en-1-yloxy;

- C₃–C₆–alkenylová skupina: prop–1–en–1–yl, prop–2–en–1–yl, 1–metylenyl, buten–1–yl, buten–2–yl, buten–3–yl, 1–metylprop–1–en–1–yl, 2–metylprop–1–en–1–yl, 1–metylprop–2–en–1–yl, 2–metylprop–2–en–1–yl, penten–1–yl, penten–2–yl, penten–3–yl, penten–4–yl, 1–metylbut–1–en–1–yl, 2–metylbut–1–en–1–yl, 3–metylbut–1–en–1–yl, 1–metylbut–2–en–1–yl, 2–metylbut–2–en–1–yl, 3–metylbut–2–en–1–yl, 1–metylbut–3–en–1–yl, 2–metylbut–3–en–1–yl, 3–metylbut–3–en–1–yl, 1,1–dimetylprop–2–en–1–yl, 1,2–dimetylprop–1–en–1–yl, 1,2–dimetylprop–2–en–1–yl, 1–etylprop–1–en–2–yl, 1–etylprop–2–en–1–yl, hex–1–en–1–yl, hex–2–en–1–yl, hex–3–en–1–yl, hex–4–en–1–yl, hex–5–en–1–yl, 1–metylpent–1–en–1–yl, 2–metylpent–1–en–1–yl, 3–metylpent–1–en–1–yl, 4–metylpent–1–en–1–yl, 1–metylpent–2–en–1–yl, 2–metylpent–2–en–1–yl, 3–metylpent–2–en–1–yl, 4–metylpent–2–en–1–yl, 1–metylpent–3–en–1–yl, 2–metylpent–3–en–1–yl, 3–metylpent–3–en–1–yl, 4–metylpent–3–en–1–yl, 1–metylpent–4–en–1–yl, 2–metylpent–4–en–1–yl, 3–metylpent–4–en–1–yl, 4–metylpent–4–en–1–yl, 1,1–dimetylbut–2–en–1–yl, 1,1–dimetylbut–3–en–1–yl, 1,2–dimetylbut–1–en–1–yl, 1,2–dimetylbut–2–en–1–yl, 1,2–dimetylbut–3–en–1–yl, 1,3–dimetylbut–1–en–1–yl, 1,3–dimetylbut–2–en–1–yl, 1,3–dimetylbut–3–en–1–yl, 2,2–dimetylbut–3–en–1–yl, 2,3–dimetylbut–1–en–1–yl, 2,3–dimetylbut–2–en–1–yl, 2,3–dimetylbut–3–en–1–yl, 3,3–dimetylbut–1–en–1–yl,

3,3-dimetylbut-2-en-1-yl, 1-etylbut-1-en-1-yl, 1-etylbut-2-en-1-yl, 1-etylbut-3-en-1-yl, 2-etylbut-1-en-1-yl, 2-etylbut-2-en-1-yl, 2-etylbut-3-en-1-yl, 1,1,2-trimetylprop-2-en-1-yl, 1-etyl-1-metylprop-2-en-1-yl, 1-etyl-2-metylprop-1-en-1-yl a 1-etyl-2-metylprop-2-en-1-yl.

Fenylové kruhy sú výhodne nesubstituované alebo môže niesť jeden až tri atómy halogénu a/alebo jednu nitroskupinu, jednu kyanoskupinu, jednu alebo dve metylové, trifluórmetylové, metoxylové alebo trifluórmetoxyllové skupiny.

Výhodné sú také zlúčeniny vzorca I, v ktorom

R^7 znamená hydroxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkoxyovú skupinu, C_3-C_6 -alkenyloxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylsulfonyloxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylkarbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylnkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok posledných dvoch uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C_1-C_4 -alkylová skupina, C_1-C_4 -halogénalkylová skupina, C_1-C_4 -alkoxylová skupina alebo C_1-C_4 -halogénalkoxylová skupina.

Výhodné sú 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom:

X znamená O;

R^1 predstavuje nitroskupinu, halogén, C_1-C_4 -alkoxyovú skupinu alebo C_1-C_4 -alkyltioskupinu; predovšetkým výhodne nitroskupinu, halogén alebo C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodným je halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, alebo C_1-C_4 -alkoxylová skupina, ako je metoxyskupina alebo etoxyskupina; pričom najvýhodnejšími sú predovšetkým chlór alebo metoxyskupina;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 znamenajú vodík, C_1-C_4 -alkylovú skupinu alebo C_1-C_4 -halogénalkylovú skupinu; predovšetkým výhodný je vodík, metyl, etyl, propyl, 1-metyletyl, fluórmetyl alebo chlórmetyl; a mimoriadne výhodným je vodík, metyl, etyl alebo chlórmetyl;

- R⁶** predstavuje C₁–C₄–alkyltioskupinu alebo C₁–C₄–alkylsulfonylovú skupinu; predovšetkým výhodne metyltio, etyltio alebo 1–metyl–1–etylthio, metylsulfonyl, etylsulfonyl, 1–metyletylsulfonyl alebo propylsulfonyl; pričom mimoriadne výhodným je metylsulfonyl, etylsulfonyl, 1–metyletylsulfonyl alebo propylsulfonyl;
- R⁷** znamená hydroxylovú skupinu, C₁–C₆–alkoxylovú skupinu, C₃–C₆–alkenyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylkarbonyloxylovú skupinu, C₁–C₄–(alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylové zvyšky posledných dvoch uvedených substituentov môžu byť čiastočne alebo úplne halogénované a/alebo môžu niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina, C₃–C₆–alkenyloxylová skupina, C₁–C₄–alkylsulfonyloxylová skupina, C₁–C₄–alkylkarbonyloxylová skupina, fenylsulfonyloxylová skupina alebo fenylkarbonyloxylová skupina, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina;
- R⁸, R⁹** predstavujú C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne metyl, etyl, propyl, 1–metyl–1–etyl, butyl, 1–metyl–1–propyl a 2–metyl–1–propyl;
- R¹⁰** znamená vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne C₁–C₄–alkylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodným je metyl, etyl alebo propyl;
- R¹¹** predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne vodík alebo metyl.

Predovšetkým výhodné sú 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

X znamená O;

R¹ predstavuje halogén alebo C₁–C₄alkoxylovú skupinu; predovšetkým výhodne halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, alebo metoxyskupina alebo etoxyskupina; pričom mimoriadne výhodným je chlór alebo metoxyskupina;

R⁶ znamená C₁–C₄alkylsulfonylovú skupinu; predovšetkým výhodne metylsulfonyl, etylsulfonyl, 1-metyl-1-ethylsulfonyl alebo propylsulfonyl;

R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, C₁–C₆alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁–C₆alkylkarbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť úplne alebo čiastočne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄alkylová skupina, C₁–C₄halogénalkylová skupina, C₁–C₄alkoxylová skupina alebo C₁–C₄halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina;

R⁸, R⁹ predstavujú C₁–C₄alkylovú skupinu;

R¹⁰ znamená vodík alebo C₁–C₄alkylovú skupinu.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

R⁸ znamená C₂–C₄alkylovú skupinu, napríklad etyl, 1-metyl-1-etyl, propyl alebo butyl;

R⁹ predstavuje C₁–C₄alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl;

R¹⁰ znamená vodík alebo C₁–C₄alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým tiež 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

- R^8 znamená metyl;
- R^9 predstavuje C_1-C_4 -alkylovú skupinu, napríklad metyl, etyl, propyl alebo butyl;
- R^{10} znamená C_1-C_4 -alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým tiež 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

- R^8, R^9 znamenajú metyl;
- R^{10} predstavuje vodík.

Výhodné sú taktiež 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom:

- X znamená O;
- R^1 predstavuje nitroskupinu, halogén, C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu alebo C_1-C_4 -alkyltioskupinu; predovšetkým výhodne nitroskupinu, halogén alebo C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodným je halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, alebo C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu, ako je metoxy alebo etoxy; pričom mimoriadne výhodným je chlór alebo metoxyskupina;
- R^2, R^3, R^4, R^5 znamenajú vodík, C_1-C_4 -alkylovú skupinu alebo C_1-C_4 -halogénalkylovú skupinu; predovšetkým výhodne vodík, metyl, etyl, propyl, 1-metyl-1-etyl, chlórmetyl alebo fluórmetyl; pričom predovšetkým výhodným je vodík, metyl, etyl alebo chlórmetyl;
- R^6 predstavuje halogén, nitroskupinu, C_1-C_4 -halogénalkylovúskupinu, C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu alebo C_1-C_4 -halogénalkoxylovú skupinu; predovšetkým výhodne halogén, ako je chlór alebo bróm, nitroskupinu,

C_1-C_2 -halogénalkylovú skupinu, ako je difluórmetyl alebo trifluórmetyl, C_1-C_2 -alkoxylovú skupinu alebo C_1-C_2 -halogénalkoxylovú skupinu, ako je difluórmetoxy, chlórdifluórmetoxy alebo trifluórmetoxy;

- R⁷** znamená hydroxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkoxylovú skupinu, C_3-C_6 -alkenyloxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylsulfonyloxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylkarbonyloxylovú skupinu, C_1-C_4 -(alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C_1-C_4 -alkylová skupina, C_1-C_4 -halogénalkylová skupina, C_1-C_4 -alkoxylová skupina alebo C_1-C_4 -halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina, C_1-C_4 -alkoxylová skupina, C_3-C_6 -alkenyloxylová skupina, C_1-C_4 -alkylsulfonyloxylová skupina, C_1-C_4 -alkylkarbonyloxylová skupina, fenylsulfonyloxylová skupina alebo fenylkarbonyloxylová skupina, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C_1-C_4 -alkylová skupina, C_1-C_4 -halogénalkylová skupina, C_1-C_4 -alkoxylová skupina alebo C_1-C_4 -halogénalkoxylová skupina;
- R⁸, R⁹** znamenajú C_1-C_4 -alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne metyl, etyl, propyl, 1-metyl-1-etyl, butyl, 1-metyl-1-propyl a 2-metyl-1-propyl;
- R¹⁰** predstavuje vodík alebo C_1-C_4 -alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne C_1-C_4 -alkylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodnými sú metyl, etyl alebo propyl;
- R¹¹** znamená vodík alebo C_1-C_4 -alkylová skupina; predovšetkým výhodne vodík alebo metyl.

Predovšetkým výhodné sú 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

- X** znamená O;
- R¹** predstavuje halogén alebo C₁–C₄–alkoxylovú skupinu; predovšetkým výhodne halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, alebo metoxy alebo etoxy; pričom predovšetkým výhodným je chlór alebo metoxyskupina;
- R⁶** znamená halogén, nitroskupinu, C₁–C₄–halogénalkylovú skupinu, C₁–C₄–alkoxylovú skupinu alebo C₁–C₄–halogénalkoxylovú skupinu; predovšetkým výhodne halogén, ako je chlór alebo bróm, nitroskupinu, C₁–C₂–halogénalkylovú skupinu, ako je difluórmetyl alebo trifluórmetyl, C₁–C₂–alkoxylovú skupinu alebo C₁–C₂–halogénalkoxylovú skupinu, ako je difluórmetoxy;
- R⁷** predstavuje hydroxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylkarbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenyلكarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina;
- R⁸, R⁹** znamenajú C₁–C₄–alkylovú skupinu;
- R¹⁰** predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

- R⁸** znamená C₂–C₄–alkylovú skupinu, napríklad etyl, 1–metyl–1–etyl, propyl alebo butyl;
- R⁹** predstavuje C₁–C₄–alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl;
- R¹⁰** predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým tiež 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

R^8 znamená metyl;

R^9 predstavuje C_1-C_4 -alkylovú skupinu, napríklad metyl, etyl, propyl alebo butyl;

R^{10} znamená C_1-C_4 -alkylovú skupinu, napríklad metyl alebo etyl.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

R^8, R^9 znamenajú metyl;

R^{10} predstavuje vodík.

Výhodné sú taktiež 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom:

X znamená $N(C_1-C_6\text{-alkyl})$; predovšetkým výhodne N -metyl, N -etyl, N -(1-metyl-1-etyl) alebo N -propyl;

R^1 predstavuje nitroskupinu, halogén, C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu alebo C_1-C_4 -alkyltioskupinu; predovšetkým výhodne nitroskupinu, halogén alebo C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodným je halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, alebo C_1-C_4 -alkoxylová skupina, ako je metoxy alebo etoxy; pričom mimoriadne výhodným je najmä chlór alebo metoxyskupina;

R^2, R^3, R^4, R^5 znamenajú vodík, C_1-C_4 -alkylovú skupinu alebo C_1-C_4 -halogénalkylovú skupinu; predovšetkým výhodne vodík, metyl, etyl, propyl, 1-metyl-1-etyl, fluórmetyl alebo chlórmetyl; pričom mimoriadne výhodným je vodík, metyl, etyl alebo chlórmetyl;

R^6 predstavuje halogén, nitroskupinu, C_1-C_4 -halogénalkylovú skupinu, C_1-C_4 -alkoxylovú skupinu, C_1-C_4 -halogénalkoxylovú skupinu, C_1-C_4 -

alkyltioskupinu, C₁–C₄–halogénalkyltioskupinu, C₁–C₄–alkylsulfonylovú skupinu alebo C₁–C₄–halogénalkylsulfonylovú skupinu; predovšetkým výhodne halogén, ako je fluór, chlór alebo bróm, nitroskupinu, C₁–C₄–halogénalkylovú skupinu, ako je difluórmetylová skupina alebo trifluórmetylová skupina, C₁–C₄–alkoxylovú skupinu, ako je metoxy alebo etoxy, C₁–C₄–halogénalkoxylovú skupinu, ako je difluórmetoxyskupina, chlórdifluórmetoxyskupina alebo trifluórmetoxyskupina, C₁–C₄–alkyltioskupinu, ako je metyltioskupina alebo etyltioskupina, alebo C₁–C₄–alkylsulfonylovú skupinu, ako je metylsulfonylová skupina, etylsulfonylová skupina, 1–metyl–1–etyl-sulfonylová skupina alebo propylsulfonylová skupina;

R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, C₁–C₆–alkoxylovú skupinu, C₃–C₆–alkenyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylkarbonyloxylovú skupinu, C₁–C₄–(alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenylkarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina, C₃–C₆–alkenyloxylová skupina, C₁–C₄–alkylsulfonyloxylová skupina, C₁–C₄–alkylkarbonyloxylová skupina, fenylsulfonyloxylová skupina alebo fenylkarbonyloxylová skupina, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo halogénovaný a/alebo môžu niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina;

R⁸, R⁹ predstavujú C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne metyl, etyl, propyl, 1–metyl–1–etyl, butyl, 1–metyl–1–propyl a 2–metyl–1–propyl;

R¹⁰ znamená vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne C₁–C₄–alkylovú skupinu; pričom mimoriadne výhodným je metyl, etyl alebo propyl;

R¹¹ predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; predovšetkým výhodne vodík alebo metyl.

Predovšetkým výhodné sú 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom

R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁–C₆–alkylkarbonyloxylovú skupinu, fenylsulfonyloxylovú skupinu alebo fenyلكarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina.

Výhodné sú podobne 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom premenné majú nižšie definované významy:

X znamená O;

R¹ predstavuje halogén alebo C₁–C₄–alkoxylovú skupinu; predovšetkým výhodne fluór, chlór, bróm, metoxy alebo etoxy; predovšetkým výhodne chlór alebo metoxy;

R², R³, R⁴, R⁵ znamenajú vodík;

R⁶ predstavuje C₁–C₄–alkylsulfonylovú skupinu; predovšetkým výhodne metylsulfonyl;

R⁷ znamená hydroxylovú skupinu, C₁–C₆–alkoxylovú skupinu, C₁–C₄–(alkyltio)–karbonyloxylovú skupinu alebo fenyلكarbonyloxylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný

a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina; predovšetkým výhodne hydroxylová skupina, C₁–C₆–alkoxylová skupina alebo fenyلكarbonyloxylová skupina, pričom fenylový zvyšok môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný

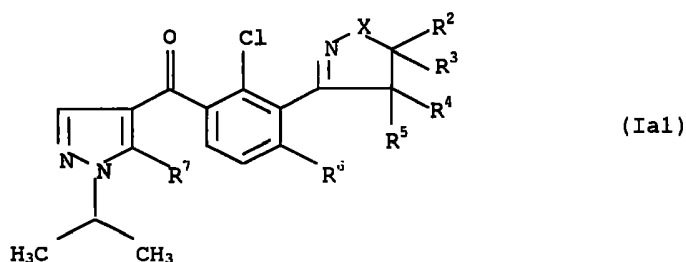
a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁–C₄–alkylová skupina, C₁–C₄–halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina;

R⁸, R⁹ predstavujú C₁–C₄–alkylovú skupinu;

R¹⁰ znamená vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu;

R¹¹ predstavuje vodík.

Veľmi výhodnými sú predovšetkým zlúčeniny vzorca Ia1 (≡I, kde R¹ = Cl; R⁸, R⁹ = CH₃; R¹⁰, R¹¹ = H), predovšetkým zlúčeniny Ia1.1 až Ia1.300 z tabuľky 1, kde definície zvyškov X a R¹ až R¹¹ majú predovšetkým význam pre zlúčeniny podľa predloženého vynálezu nie len v kombinácii s inými, ale v každom prípade tiež samotné.

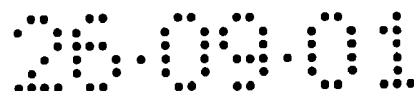


Tabuľka 1

No.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ia1.1	O	H	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.2	O	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.3	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH

la1.4	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.5	O	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.6	O	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.7	O	H	H	H	H	Cl	OH
la1.8	O	H	H	H	H	Br	OH
la1.9	O	H	H	H	H	NO ₂	OH
la1.10	O	H	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.11	O	H	H	H	H	CF ₃	OH
la1.12	O	H	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.13	O	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.14	O	H	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.15	O	H	H	H	H	OCF ₃	OH
la1.16	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
la1.17	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.18	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.19	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.20	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.21	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.22	O	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
la1.23	O	CH ₃	H	H	H	Br	OH
la1.24	O	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
la1.25	O	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.26	O	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
la1.27	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.28	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.29	O	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.30	O	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
la1.31	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
la1.32	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.33	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.34	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.35	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.36	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.37	O	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
la1.38	O	H	H	CH ₃	H	Br	OH
la1.39	O	H	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
la1.40	O	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
la1.41	O	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
la1.42	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
la1.43	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.44	O	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
la1.45	O	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
la1.46	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
la1.47	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.48	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.49	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.50	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.51	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.52	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
la1.53	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH
la1.54	O	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH

la1.55	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
la1.56	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
la1.57	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH
la1.58	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.59	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
la1.60	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
la1.61	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
la1.62	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.63	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.64	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.65	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.66	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.67	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
la1.68	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
la1.69	O	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
la1.70	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
la1.71	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
la1.72	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
la1.73	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.74	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
la1.75	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
la1.76	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
la1.77	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.78	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
la1.79	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.80	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.81	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.82	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
la1.83	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
la1.84	O	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
la1.85	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
la1.86	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
la1.87	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
la1.88	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.89	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
la1.90	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
la1.91	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
la1.92	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.93	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.94	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.95	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.96	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.97	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
la1.98	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
la1.99	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
la1.100	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
la1.101	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
la1.102	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
la1.103	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.104	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
la1.105	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH



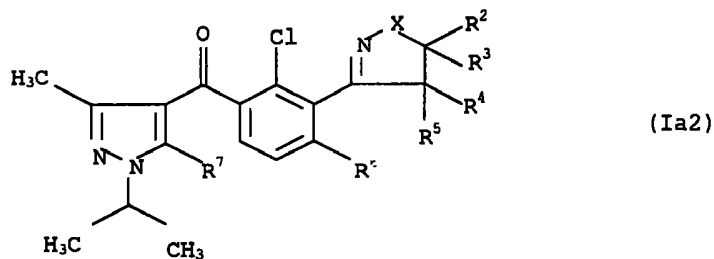
la1.106	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
la1.107	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.108	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
la1.109	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.110	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.111	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.112	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
la1.113	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
la1.114	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
la1.115	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
la1.116	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
la1.117	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
la1.118	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.119	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
la1.120	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
la1.121	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
la1.122	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.123	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
la1.124	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.125	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.126	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.127	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
la1.128	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
la1.129	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
la1.130	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
la1.131	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
la1.132	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
la1.133	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.134	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
la1.135	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
la1.136	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
la1.137	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.138	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.139	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.140	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.141	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.142	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
la1.143	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
la1.144	O	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
la1.145	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.146	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
la1.147	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.148	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.149	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.150	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH
la1.151	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₃	OH
la1.152	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.153	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.154	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.155	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.156	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH

la1.157	NCH ₃	H	H	H	H	Cl	OH
la1.158	NCH ₃	H	H	H	H	Br	OH
la1.159	NCH ₃	H	H	H	H	NO ₂	OH
la1.160	NCH ₃	H	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.161	NCH ₃	H	H	H	H	CF ₃	OH
la1.162	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.163	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.164	NCH ₃	H	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.165	NCH ₃	H	H	H	H	OCF ₃	OH
la1.166	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
la1.167	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.168	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.169	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.170	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.171	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.172	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
la1.173	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Br	OH
la1.174	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
la1.175	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.176	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
la1.177	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.178	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.179	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.180	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
la1.181	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
la1.182	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.183	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.184	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.185	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.186	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.187	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
la1.188	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	Br	OH
la1.189	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
la1.190	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
la1.191	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
la1.192	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
la1.193	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.194	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
la1.195	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
la1.196	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
la1.197	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.198	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.199	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.200	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.201	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.202	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
la1.203	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH
la1.204	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH
la1.205	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
la1.206	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
la1.207	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH

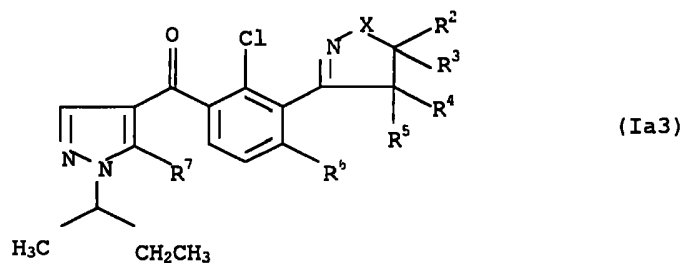
Ia1.208	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.209	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.210	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.211	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.212	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.213	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.214	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.215	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.216	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.217	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.218	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.219	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.220	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.221	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.222	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.223	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.224	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.225	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.226	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.227	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.228	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.229	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.230	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.231	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.232	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.233	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.234	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.235	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.236	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.237	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.238	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.239	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.240	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.241	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.242	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.243	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.244	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.245	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.246	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.247	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.248	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.249	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.250	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.251	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.252	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.253	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.254	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.255	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.256	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.257	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.258	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH

la1.259	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.260	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.261	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.262	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
la1.263	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
la1.264	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
la1.265	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
la1.266	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
la1.267	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
la1.268	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.269	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
la1.270	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
la1.271	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
la1.272	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.273	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
la1.274	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.275	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.276	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.277	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
la1.278	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
la1.279	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
la1.280	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
la1.281	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
la1.282	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
la1.283	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.284	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
la1.285	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
la1.286	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
la1.287	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
la1.288	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
la1.289	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
la1.290	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
la1.291	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
la1.292	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
la1.293	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
la1.294	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
la1.295	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
la1.296	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
la1.297	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
la1.298	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
la1.299	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
la1.300	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH

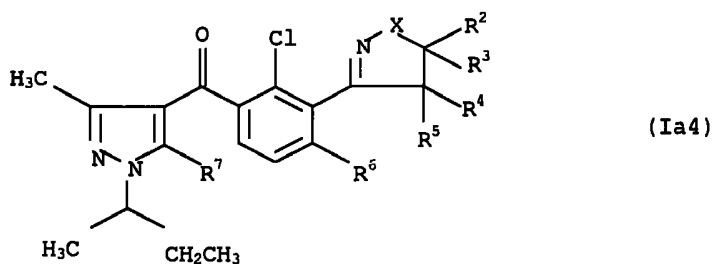
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca la2, predovšetkým zlúčeniny la2.1 až la2.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín la1.1 až la1.300 tým, že R¹¹ znamená metyl.



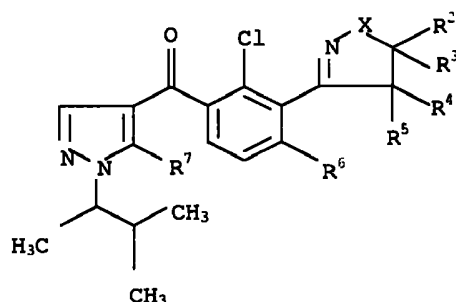
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia3, predovšetkým zlúčeniny Ia3.1 až Ia3.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^8 znamená etyl.



Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia4, predovšetkým zlúčenín Ia4.1 až Ia4.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^8 znamená etyl a R^{11} znamená metyl.

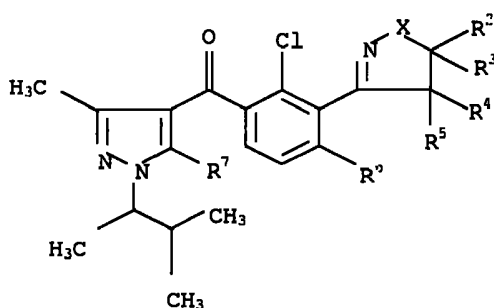


Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia5, predovšetkým zlúčeniny Ia5.1 až Ia5.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^8 znamená 1-metyl-1-etyl.



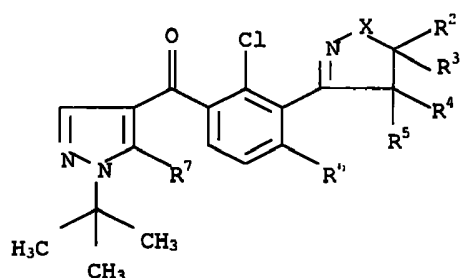
(Ia5)

Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia6, predovšetkým zlúčeniny Ia6.1 až Ia6.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^8 znamená 1-metyl-1-etyl a R^{11} znamená metyl.



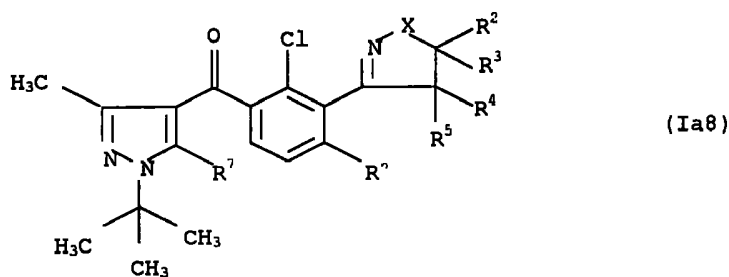
(Ia6)

Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia7, predovšetkým zlúčeniny Ia7.1 až Ia7.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^{10} znamená metyl.

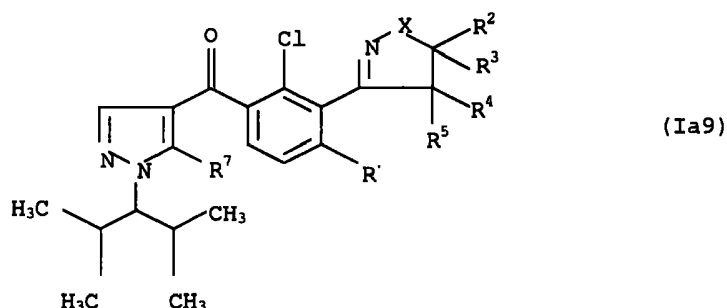


(Ia7)

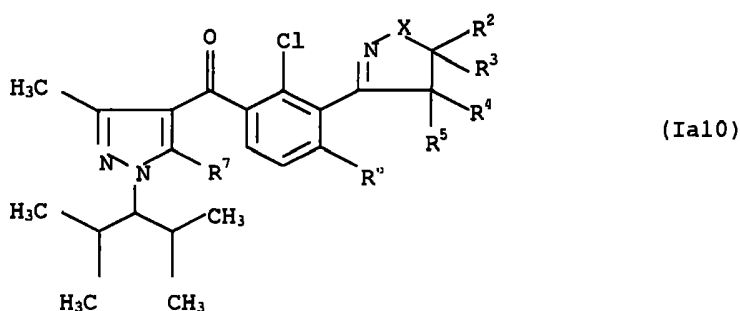
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia8, predovšetkým zlúčeniny Ia8.1 až Ia8.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^{10} znamená metyl a R^{11} predstavuje metyl.



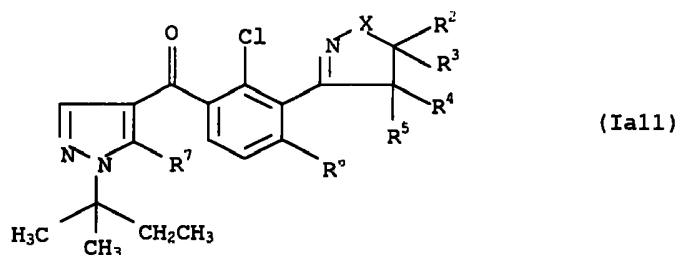
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia9, predovšetkým zlúčeniny Ia9.1 až Ia9.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R⁸ a R⁹ znamenajú 1-metyl-1-etyl.



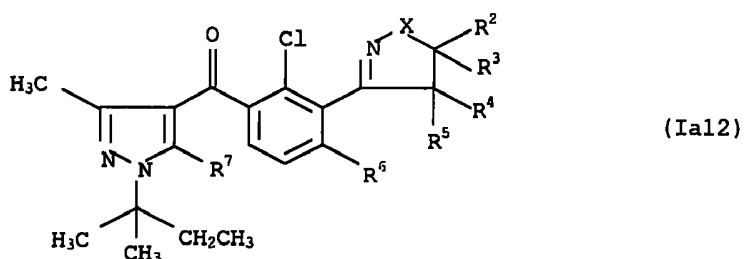
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia10, predovšetkým zlúčeniny Ia10.1 až Ia10.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R⁸ a R⁹ znamenajú 1-metyl-1-etyl a R¹¹ predstavuje metyl.



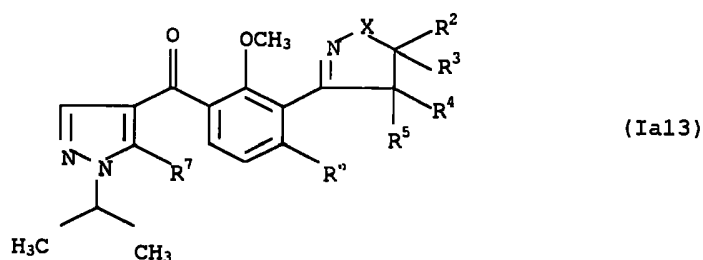
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia11, predovšetkým zlúčeniny Ia11.1 až Ia11.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R⁸ znamená etyl a R¹⁰ znamená metyl.



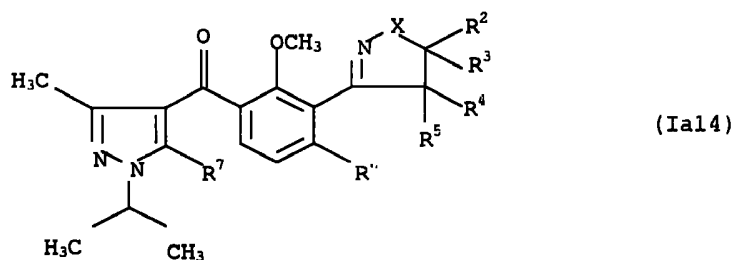
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia12, predovšetkým zlúčeniny Ia12.1 až Ia12.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R⁸ znamená etyl a R¹⁰ a R¹¹ predstavuje metyl.



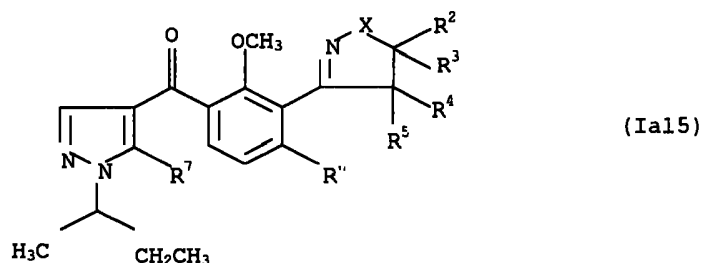
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia13, predovšetkým zlúčeniny Ia13.1 až Ia13.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R¹ znamená metoxy.



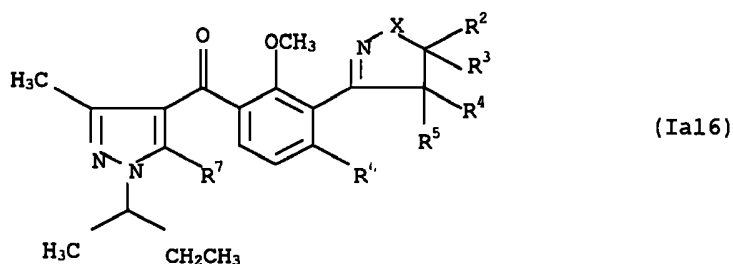
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia14, predovšetkým zlúčeniny Ia14.1 až Ia14.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R¹ znamená metoxy a R¹¹ predstavuje metyl.



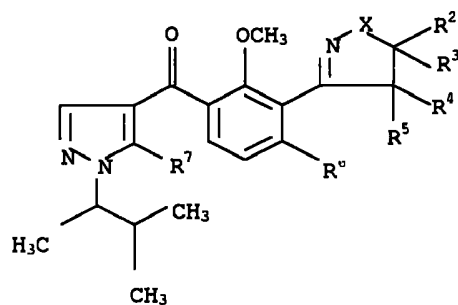
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia15, predovšetkým zlúčeniny Ia15.1 až Ia15.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy a R^8 znamená etyl.



Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia16, predovšetkým zlúčeniny Ia16.1 až Ia16.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy, R^8 znamená etyl a R^{11} predstavuje metyl.

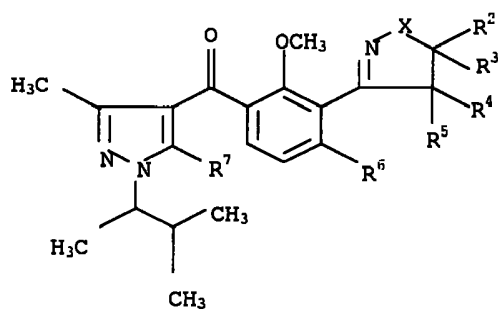


Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia17, predovšetkým zlúčeniny Ia17.1 až Ia17.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy a R^8 znamená 1-metyl-1-etyl.



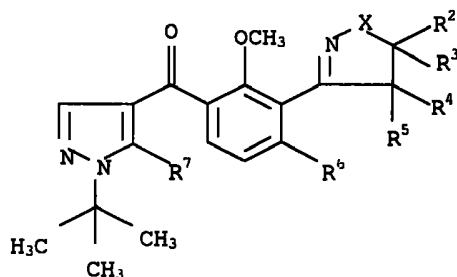
(Ia17)

Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia18, predovšetkým zlúčeniny Ia18.1 až Ia18.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy, R^8 znamená 1-metyl-1-etyl a R^{11} predstavuje metyl.



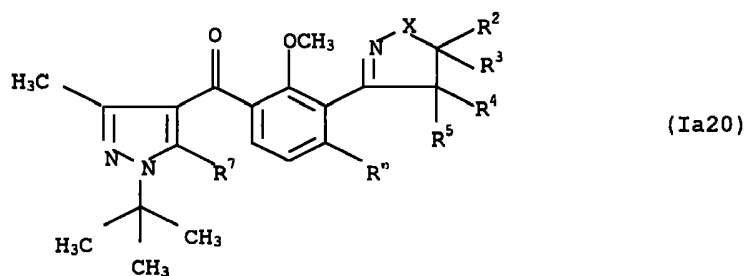
(Ia18)

Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia19, predovšetkým zlúčeniny Ia19.1 až Ia19.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy a R^{10} predstavuje metyl.

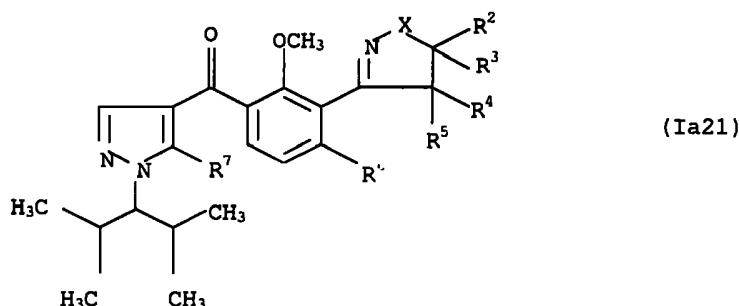


(Ia19)

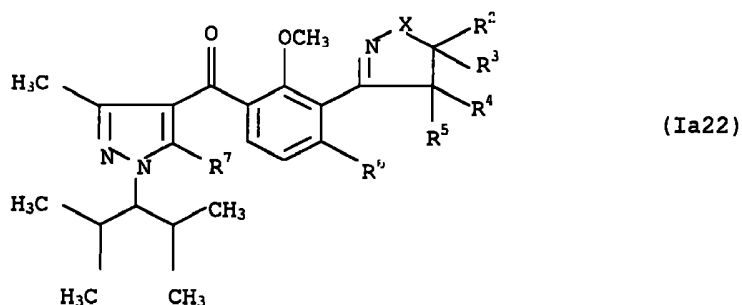
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia20, predovšetkým zlúčeniny Ia20.1 až Ia20.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy, R^{10} predstavuje metyl a R^{11} znamená metyl.



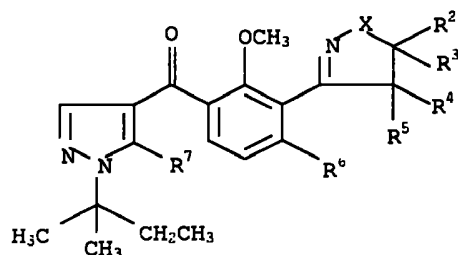
Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia21, predovšetkým zlúčeniny Ia21.1 až Ia21.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R¹ znamená metoxy a R⁸ a R⁹ predstavujú 1-metyl-1-etyl.



Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia22, predovšetkým zlúčeniny Ia22.1 až Ia22.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R¹ znamená metoxy, R⁸ a R⁹ predstavujú 1-metyl-1-etyl a R¹¹ znamená metyl.

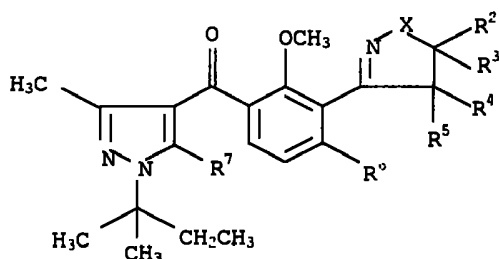


Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia23, predovšetkým zlúčeniny Ia23.1 až Ia23.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R¹ znamená metoxy, R⁸ predstavuje etyl a R¹⁰ znamená metyl.



(Ia23)

Mimoriadne výhodné sú tiež zlúčeniny vzorca Ia24, predovšetkým zlúčeniny Ia24.1 až Ia24.300, ktoré sa odlišujú od zodpovedajúcich zlúčenín Ia1.1 až Ia1.300 tým, že R^1 znamená metoxy, R^8 predstavuje etyl a R^{10} a R^{11} znamenajú metyl.

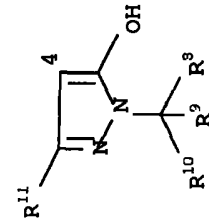
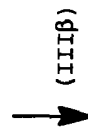
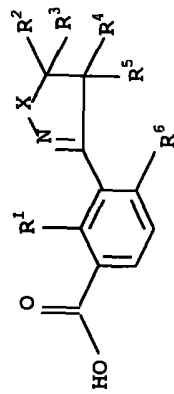


(Ia24)

3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I sa môžu pripraviť rozličnými cestami, napríklad spôsobom, ktorý je uvedený nižšie.

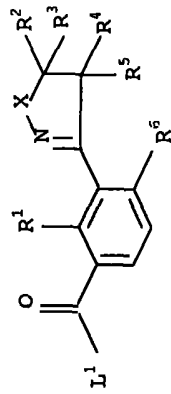
Spôsob A:

Reakciou pyrazolov vzorca II s aktivovanou kyselinou benzoovou III α alebo kyselinou benzoovou III β , ktorá sa výhodne aktivuje *in situ*, za vzniku zodpovedajúceho acylačného produktu IV, a následným prešmykom, pričom sa získajú zlúčeniny vzorca I, v ktorom $R^7 = OH$.

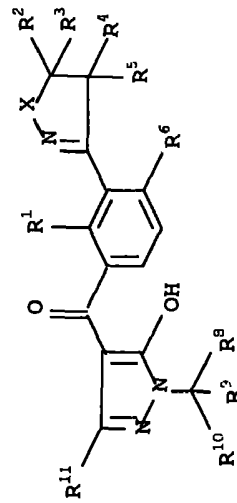


(II)

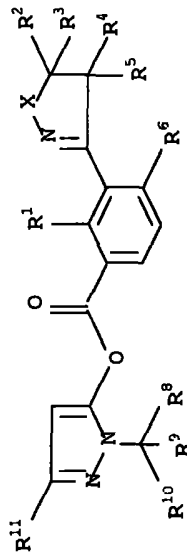
+



(IIIα)



(I) where R⁷ = OH



(IV)

L¹ znamená nukleofilne nahraditeľnú odstupujúcu skupinu, ako je halogén, napríklad bróm, chlór, hetaryl, napríklad imidazolyl, pyridyl, karboxylát, napríklad acetát, trifluóracetát a podobne.

Aktivovaná benzoová kyselina sa môže použiť priamo, ako v prípade benzoylhalogenidov, alebo sa môže generovať *in situ*, napríklad s použitím dicyklohexylkarbodiimidu, trifenyľfosfínu/esteru kyseliny azodikarboxylovej, 2-pyridíndisulfidu/trifenyľfosfínu, karbonyldiimidazolu, a podobne.

Výhodné môže byť uskutočniť acylačnú reakciu v prítomnosti zásady. Reakčné činidlá a pomocná zásada sa tu výhodne použijú v ekvimolárnych množstvách. V určitých prípadoch môže byť výhodný mierny nadbytok pomocnej zásady, napríklad od 1,2 do 1,5 molárnych ekvivalentov, vzťahnuté na zlúčeninu vzorca II.

Vhodnými pomocnými zásadami sú terciárne alkylamíny, pyridín alebo uhličitany alkalických kovov. Ako rozpúšťadlá sú vhodné na použitie napríklad chlórované uhľovodíky, ako je metylénchlorid, 1,2-dichlóretán, aromatické uhľovodíky, ako je toluén, xylén, chlórbenzén, étery, ako je dietyléter, metyl-*terc*-butyléter, dimetoxyetán, tetrahydrofurán, dioxán, polárne aprotické rozpúšťadlá, ako je acetonitril, dimetylformamid, dimetylsulfoxid, alebo estery, ako je etylacetát, alebo ich zmesi.

V prípade, že použitými aktivovanými zložkami karboxylovej kyseliny sú benzoylhalogenidy, môže byť výhodné ochladiť reakčnú zmes pri pridaní tohto reakčného partnera na teplotu 0 až 10 °C. Zmes sa následne mieša pri teplote 20 až 100 °C, výhodne pri teplote 25 až 50 °C, až do ukončenia reakcie. Spracovanie sa uskutočňuje zvyčajným spôsobom, napríklad vliatím reakčnej zmesi do vody a extrahovaním produktu. Rozpúšťadlami, ktoré sú predovšetkým vhodné na tento účel, sú metylénchlorid, dietyléter, dimetoxyetán a etylacetát. Organická fáza sa vysuší a rozpúšťadlo sa odstráni, pričom sa takto získaný surový ester môže použiť na prešmyk bez ďalšieho čistenia.

Prešmyk esterov za vzniku zlúčenín vzorca I sa výhodne uskutočňuje pri teplote 20 až 40 °C v rozpúšťadle v prítomnosti zásady a, ak je to potrebné, s použitím kyanozlúčenín ako katalyzátora.

Vhodnými rozpúšťadlami sú napríklad acetonitril, metylénchlorid, 1,2-dichlóretán, dioxán, etylacetát, dimetoxetán, toluén alebo ich zmesi. Výhodnými rozpúšťadlami sú acetonitril a dioxán.

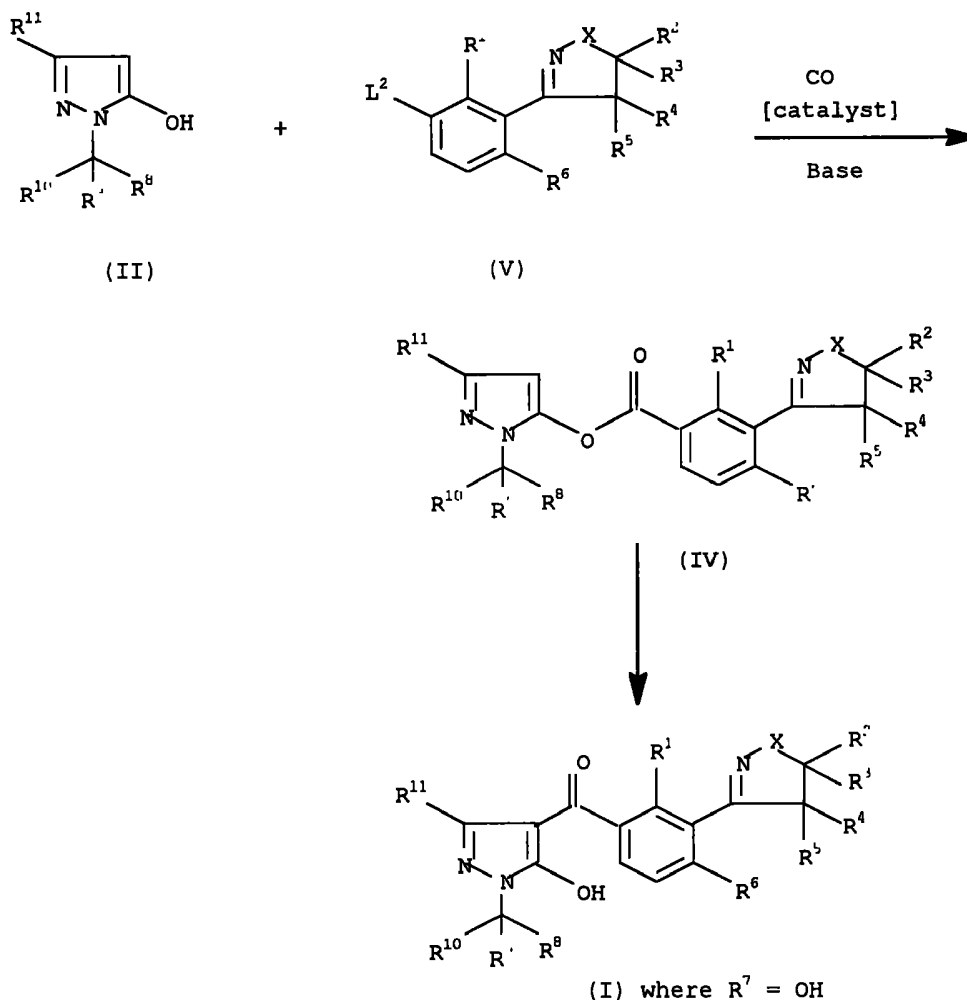
Vhodnými zásadami sú terciárne amíny, ako je trietylamín alebo pyridín, alebo uhličitan alkalických kovov, ako uhličitan sodný alebo uhličitan draselný, ktoré sa výhodne používajú v ekvimolárnom množstve alebo až do štvornásobného nadbytku, vzťahnuté na ester. Výhodné je použitie trietylamínu alebo uhličitanu alkalických kovov, výhodne v dvojnásobnom ekvimolárnom množstve, vzťahnuté na ester.

Vhodnými kyanozlúčeninami sú anorganické kyanidy, ako je kyanid sodný a kyanid draselný, a organické kyanozlúčeniny, ako je acetonkyanhydrín a trimetylsilylkyanid. Tieto sa používajú v množstve od 1 do 50 molárnych percent, vzťahnuté na ester. Výhodné je použitie acetonkyanhydrínu alebo trimetylsilylkyanidu, napríklad v množstve od 5 do 15 molárnych percent, výhodne 10 molárnych percent, vzťahnuté na ester.

Spracovanie sa môže uskutočniť spôsobom, ktorý je všeobecne známy. Reakčná zmes sa napríklad okyslí so zriedenou minerálnou kyselinou, ako je 5 %-ná kyselina chlorovodíková alebo kyselina sírová, a extrahuje sa s organickým rozpúšťadlom, napríklad s metylénchloridom alebo etylacetátom. Organický extrakt sa môže extrahovať s 5- až 10 %-ným roztokom uhličitanu alkalického kovu, napríklad s roztokom uhličitanu sodného alebo uhličitanu draselného. Vodná fáza sa okyslí a výsledná zrazenina sa odfiltruje odsatím a/alebo sa extrahuje s metylénchloridom alebo etylacetátom, a zmes sa vysuší a zahusťí.

(Príklady prípravy esterov hydroxypyrazolov a príklady na prešmyk esterov sú uvedené napríklad v dokumentoch EP-A 282 944 a US 4 643 757).

Avšak je taktiež možné pripraviť „acylačný produkt“ vzorca IV in situ, reakciou pyrazolu vzorca II, alebo jeho alkalickej kovovej soli, s 3–(heterocyklyl)benzénovým derivátom vzorca V, v prítomnosti oxidu uhoľnatého, katalyzátora a zásady.



L^2 znamená odstupujúcu skupinu, ako je halogén, napríklad chlór, bróm alebo jód, alebo sulfonát, ako je mezylát alebo triflát; pričom výhodným je bróm alebo triflát.

„Acylačný produkt“ vzorca IV môže reagovať priamo alebo nepriamo, za vzniku 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu vzorca I.

Vhodnými katalyzátormi sú komplexy ligandov paládia, v ktorých je paládium prítomné v oxidačnom stupni 0, kovové paládium, ktoré je prípadne naabsorbované na nosiči, a výhodne dvojmocné soli paládia. Reakcia s dvojmocnými soľami

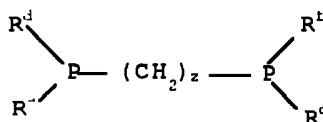
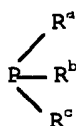
paládia a kovovým paládiom sa výhodne uskutočňuje v prítomnosti komplexných ligandov.

Príkladom vhodných komplexov ligandov paládia(0) je tetrakis(trifenylfosfín)-paládium.

Kovové paládium sa výhodne absorbuje na inertnom nosiči, ako je napríklad aktívne uhlie, oxid kremičitý, oxid hlinitý, síran bárnatý alebo uhličitan vápenatý. Reakcia sa výhodne uskutočňuje v prítomnosti komplexných ligandov, ako je napríklad trifenylfosfín.

Príkladmi vhodných solí paládia(II) je octan paladnatý a chlorid paladnatý. Výhodná je prítomnosť komplexných ligandov, ako je napríklad trifenylfosfín.

Vhodné komplexné ligandy pre komplexy ligandov paládia alebo v prítomnosti ktorých sa výhodne uskutočňuje reakcia s kovovým paládiom alebo s dvojmocnými soľami paládia, sú terciárne fosfíny, ktorých štruktúra je reprezentovaná nasledujúcimi vzorcami:



kde z znamená 1 až 4 a zvyšky R^a až R^g znamenajú C_1 - C_6 -alkylovú skupinu, C_3 - C_6 -cykloalkylovú skupinu, aryl- C_1 - C_2 -alkylovú skupinu alebo, výhodne, aryllovú skupinu. Arylom je napríklad naftyl a nesubstituovaný alebo substituovaný fenyl, ako je napríklad 2-tolyl a, predovšetkým, nesubstituovaný fenyl.

Komplexné paládiové soli sa môžu pripraviť s použitím všeobecne známeho postupu, pričom sa vychádza z komerčne dostupných paládiových solí, ako je chlorid paladnatý alebo octan paladnatý a vhodných fosfínov, ako je napríklad trifenylfosfín alebo 1,2-bis(difenylfosfín)etán. Mnohé z komplexných paládiových solí sú komerčne dostupné. Výhodnými paládiovými soľami sú [(R)(+)-2,2'-bis(difenylfosfín)-1,1'-binaftyl]paládium(II)chlorid,

bis(trifenyľfosfín)paládium(II)acetát a predovšetkým bis(trifenyľfosfín)-paládium-(II)chlorid.

Paládiový katalyzátor sa zvyčajne používa v koncentrácii od 0,05 do 5 molárných percent a výhodne 1 až 3 molárne percentá.

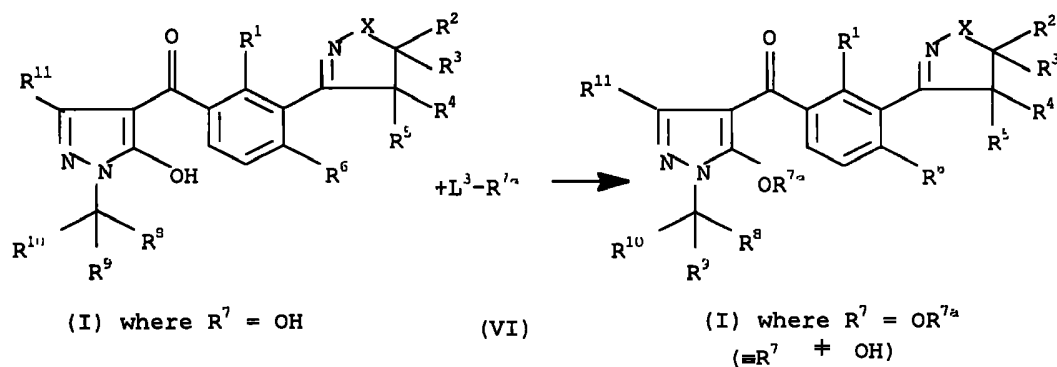
Vhodnými zásadami sú terciárne amíny, ako je napríklad N-metylpiperidín, etyldiizopropylamín, 1,8-bisdimetylaminonaftalén alebo predovšetkým trietylamín. Taktiež vhodné sú uhľičitany alkalických kovov, ako je napríklad uhľičitan sodný alebo uhľičitan draselný. Vhodné sú však tiež zmesi uhľičitanu draselného a trietylamínu.

Vo všeobecnosti sa používa od 2 do 4 molárných ekvivalentov, predovšetkým 2 molárne ekvivalenty, uhľičitanu alkalického kovu a od 1 do 4 molárne ekvivalenty, predovšetkým 2 molárne ekvivalenty, terciárneho amínu, vzťahnuté na 3-(heterocyklyl)benzénový derivát vzorca V.

Vhodnými rozpúšťadlami sú nitrily, ako je benzonitril a acetonitril, amidy, ako je dimetylformamid, dimetylacetamid, tetra-C₁-C₄-alkylmočoviny alebo N-metylpyrolidón, a výhodne étery, ako je tetrahydrofurán a metyl-*tert*-butyléter. Predovšetkým výhodné sú étery, ako je 1,4-dioxán a dimetoxetán.

Spôsob B:

Zlúčeniny vzorca I, v ktorom R⁷ ≠ hydroxylovú skupinu, sa získajú reakciou zlúčenín vzorca I, v ktorom R⁷ = hydroxylová skupina, s alkylačnými činidlami, sulfonylačnými činidlami alebo acylačnými činidlami L³-R^{7a} (VI).



L^3 znamená nukleofilne nahraditeľnú odstupujúcu skupinu, ako je halogén, napríklad bróm alebo chlór, acyloxylovú skupinu, napríklad acetyloxy, etylkarbonyloxy, alebo alkylsulfonyloxy, napríklad metylsulfonyloxy alebo trifluórmethylsulfonyloxy.

R^{7a} znamená C_1-C_6 -alkylovú skupinu, C_3-C_6 -alkenylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylsulfonyloxylovú skupinu, C_1-C_6 -alkylkarbonylovú skupinu, C_1-C_6 -(alkyltio)-karbonylovú skupinu, fenylylsulfonylovú skupinu alebo fenylylkarbonylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C_1-C_4 -alkylová skupina, C_1-C_4 -halogénalkylová skupina, C_1-C_4 -alkoxylová skupina alebo C_1-C_4 -halogénalkoxylová skupina.

Zlúčeniny vzorca VI sa môžu použiť priamo, ako napríklad v prípade sulfonylhalogenidov alebo anhydridov kyseliny sulfónovej, alebo sa generovať *in situ*, napríklad aktivovať sulfónové kyseliny (s použitím kyseliny sulfónovej a dicyklohexyl-karbonyldiimidu, karbonyldiimidazolu, a podobne).

Východiskové materiály sa vo všeobecnosti používajú v ekvimolárnych množstvách. Avšak výhodným môže byť tiež použitie nadbytku jednej zložky alebo druhej zložky.

Prípadne môže byť výhodné, ak sa reakcia uskutočňuje v prítomnosti zásady. Reakčné činidlá a pomocná zásada sa tu výhodne používajú v ekvimolárnych množstvách. V určitých prípadoch môže byť výhodný nadbytok pomocnej zásady, napríklad od 1,5 do 3 molárnych ekvivalentov, vzťahnuté na zlúčeninu vzorca I.

Vhodnými pomocnými zásadami sú terciárne alkylamíny, ako je napríklad trietylamín, pyridín, uhličitany alkalických kovov, napríklad uhličitán sodný alebo uhličitán draselný, a hydridy alkalických kovov, napríklad hydrid sodný. Výhodné je použitie trietylamínu a pyridínu.

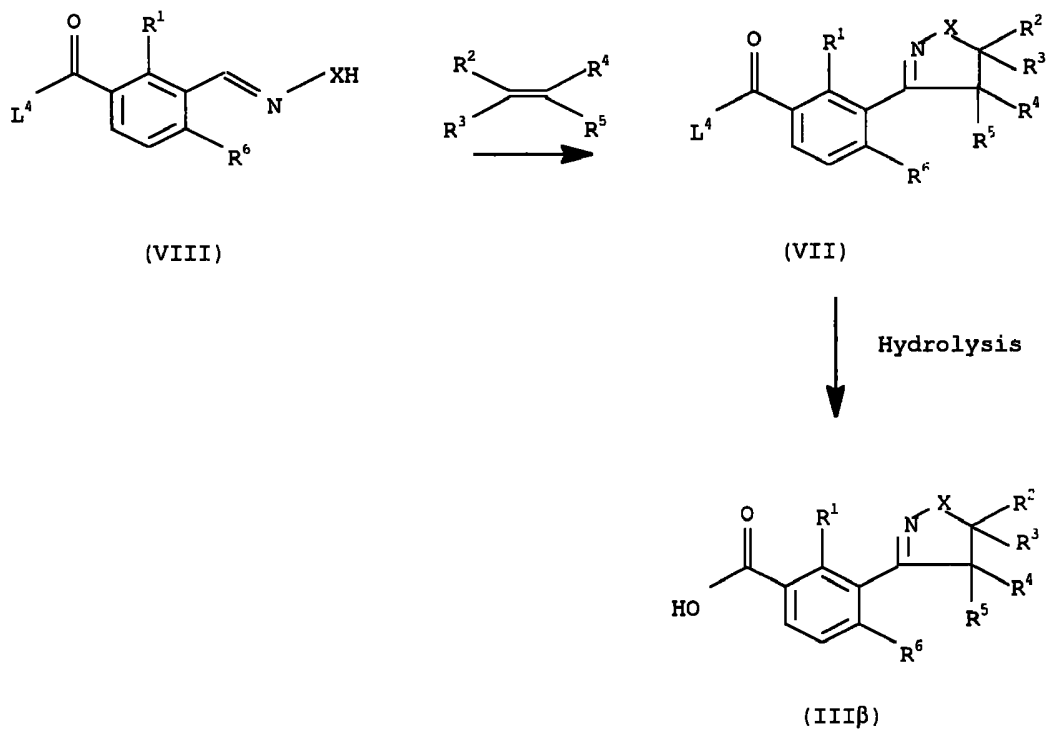
Vhodnými rozpúšťadlami sú napríklad chlórované uhľovodíky, ako je napríklad metylénchlorid a 1,2-dichlóretán, aromatické uhľovodíky, napríklad toluén, xylén, chlórbenzén, étery, ako je dietyléter, metyl-*terc*-butyléter, tetrahydrofurán a dioxán, polárne aprotické rozpúšťadlá, ako je acetonitril, dimetylformamid, dimetylsulfoxid, alebo estery, ako je etylacetát, alebo ich zmesi.

Vo všeobecnosti sa reakčná teplota pohybuje v rozsahu od 0 °C po teplotu varu reakčnej zmesi.

Spracovanie sa môže uskutočňovať spôsobom, ktorý je všeobecne známy, pričom sa získa produkt.

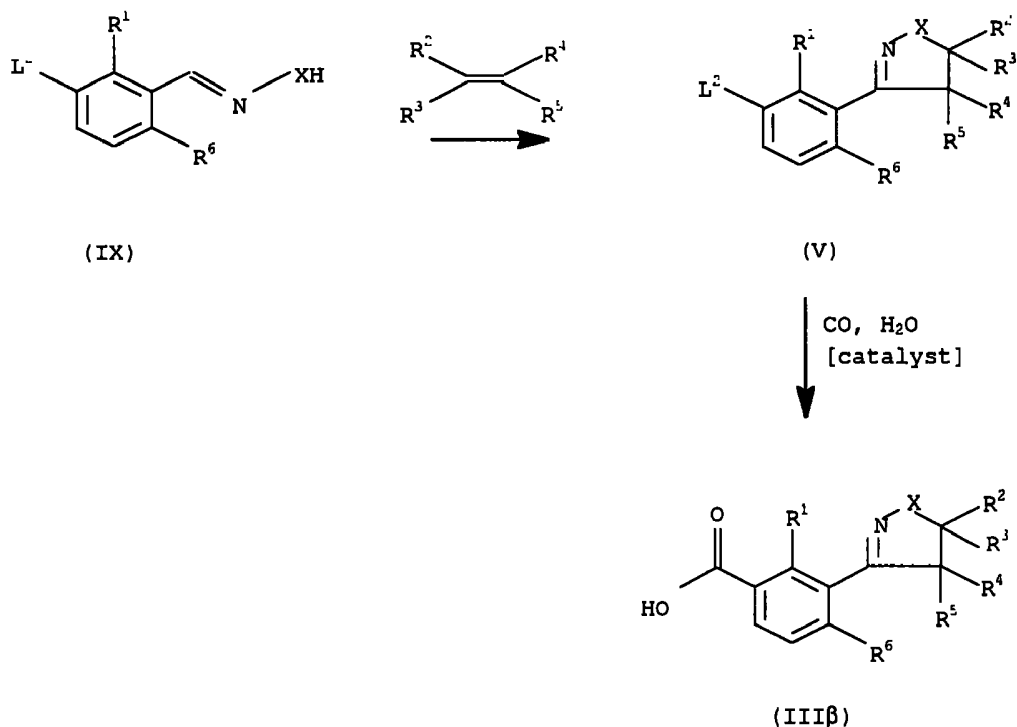
Pyrazoly vzorca II, ktoré sa používajú ako východiskové materiály, sú známe, alebo sa môžu pripraviť s použitím spôsobov, ktoré sú všeobecne známe (napríklad EP-A 240 001 a J. Prakt. Chem. 315, 383 (1973)).

Aktivované benzoové kyseliny vzorca III α sa môžu získať s použitím spôsobu, ktorý je bežne známy, z benzoových kyselín vzorca III β . Posledne menované sa získajú hydrolýzou zodpovedajúcich esterov vzorca VII. Tieto sa môžu pripraviť konverziou oxímu alebo hydrazónu vzorca VIII na zodpovedajúci halogenid kyseliny hydroxámovej, predovšetkým chlorid kyseliny hydroxámovej, alebo karbohydrazidhalogenid, predovšetkým karbohydrazidchlorid; pričom sa získa nitriloxid alebo nitrilimín *in situ* a tento sa nechá reagovať s alkénom (porovnaj napríklad Chem. Ber. 106, 3258 – 3274 (1973)).



L^4 znamená C_1-C_6 -alkoxylový zvyšok.

Avšak, benzoové kyseliny vzorca IIIβ sa môžu tiež pripraviť konverziou oxímu alebo hydrazónu vzorca IX na zodpovedajúce nitriloxidy alebo nitrilimíny a tieto sa nechajú reagovať s alkénmi, za vzniku zodpovedajúcich cykloadičných produktov (porovnaj napríklad Chem. Ber. 106, 3252 – 3274 (1973)). Teda, napríklad oxím vzorca IX ($X = O$) sa oxiduje s chlórnanom sodným a nechá sa reagovať s vhodným alkénom v inertnom rozpúšťadle, ako je metylénchlorid, chloroform, tetrahydrofurán, dioxán alebo acetonitril. Produkt sa potom, v prítomnosti katalyzátora a zásady, konvertuje na kyselinu benzoovú vzorca IIIβ, s použitím oxidu uhoľnatého a vody.



L² znamená odstupujúcu skupinu, ako je halogén, napríklad chlór, bróm alebo jód, alebo sulfonátu, ako je mezylát alebo triflát; výhodne bróm alebo triflát.

Pokiaľ ide o karbonylačnú reakciu, analogicky platí to, čo bolo uvedené vyššie.

Príklady uskutočnenia vynálezu

4-[2-Chlór-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-metylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimetyl-1-etyl)-1H-pyrazol (zlučenie 1)

2,32 g (0,02 mol) 1-(1,1-dimetyl-1-etyl)-5-hydroxy-1H-pyrazolu a 2,3 g (0,02 mol) uhličitanu draselného sa pridalo k roztoku 5,4 g (0,02 mol) 2-chlór-3-(4,5-dihydro-izoxazol-3-yl)-4-metylsulfonylbenzoylchloridu v 100 ml etylénglykol-dimetyl-éteru a zmes sa miešala cez noc. Zmes sa potom nechala refluxovať počas 3 hodín, rozpúšťadlo sa oddestilovalo, zvyšok sa vytrepal v 300 ml vody a premyl sa s metylénchloridom a vodná fáza sa okyslila na hodnotu pH = 3 s použitím 10 %-nej kyseliny chlorovodíkovej. Zrazenina sa odfiltrovala odsátím a vysušila sa pri teplote 40 °C. Takto sa získalo 4,6 g (65 % teórie) 4-[2-chlór-3-(4,5-

dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazolu].

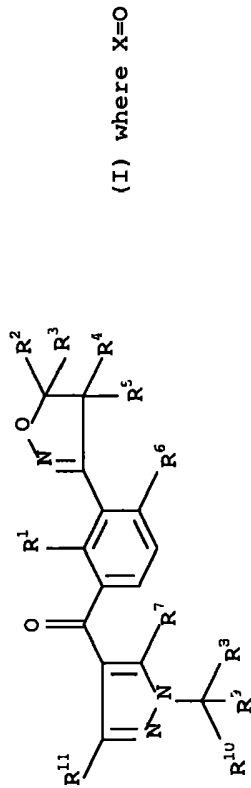
Okrem vyššie uvedenej zlúčeniny sú v tabuľke 2 zosumarizované ďalšie 3-(heterocyklyl)substituované benzoylpyrazoly vzorca I, ktoré sa pripravili alebo sa dajú pripraviť s použitím analogických postupov.

.

.

.

.



Tabuľka 2:

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Fyzikálne údaje t.t.[°C] ¹ H-NMR [δ v ppm]
2.1	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	198–200
2.2	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	H	H	210–215
2.3	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	175–180
2.4	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	150–155
2.5	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	185–190
2.6	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	H	H	225–230
2.7	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	H	220–225
2.8	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3,5-F ₂ -C ₆ H ₃]	CH ₃	CH ₃	H	H	220–225
2.9	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	150–155
2.10	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	125–130
2.11	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	135–140
2.12	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	130–135
2.13	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	H	H	154–156
2.14	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOSCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Olej
2.15	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	200–205
2.16	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	65–70
2.17	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	Olej
2.18	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	H	H	78–79

3—(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I a ich poľnohospodársky využiteľné soli sú vhodné, ako vo forme izomérnych zmesí tak aj vo forme čistých izomérov, ako herbicídy. Herbicídne kompozície obsahujúce zlúčeniny vzorca I veľmi účinne ničia vegetáciu na nepestovateľských plochách, predovšetkým pri vysokých dávkach aplikácie. Pôsobia proti širokolistým burinám a škodlivým trávam v plodinách, ako je pšenica, ryža, kukurica, sója a bavlník, bez toho aby spôsobili akékoľvek signifikantné poškodenie poľnohospodárskych plodín. Tento účinok sa pozoruje predovšetkým pri nízkych aplikačných dávkach.

V závislosti od použitého spôsobu aplikácie, zlúčeniny vzorca I, alebo kompozície ktoré ich obsahujú, sa môžu okrem toho použiť v celom rade ďalších poľnohospodárskych plodín na elimináciu nežiaducich rastlín. Príkladmi vhodných plodín sú nasledujúce:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris druh *altissima*, *Beta vulgaris* druh *rapa*, *Brassica napus* odroda *napus*, *Brassica napus* odroda *napobrassica*, *Brassica rapa* odroda *silvestris*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum*, (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus* druh, *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa* druh, *Nicotiana tabacum* (*N.rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus* druh, *Pisum sativum*, *Prunus avium*, *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Ribes sylvestre*, *Ricinus communis*, *Saccharum officinarum*, *Secale cereale*, *Solanum tuberosum*, *Sorghum bicolor* (*S. vulgare*), *Theobroma cacao*, *Trifolium pratense*, *Triticum aestivum*, *Triticum durum*, *Vicia faba*, *Vitis vinifera* a *Zea mays*.

Okrem toho sa zlúčeniny vzorca I môžu použiť v poľnohospodárskych plodinách, ktoré sú tolerantné na účinok herbicídov z dôvodu šľachtenia, vrátane metód genetického inžinierstva.

Zlúčeniny vzorca I alebo herbicídne kompozície, ktoré ich obsahujú, sa môžu použiť napríklad vo forme priamo striekateľných vodných roztokov, práškov, suspenzií, tiež vysoko koncentrovaných vodných, olejových alebo iných suspenzií alebo disperzií, emulzií, olejových disperzií, pást, poprašovacích prostriedkov, posypových prostriedkov alebo granulátov, postrekovaním, rozstrekaním vo forme hmly, rozprašovaním, rozsýpaním alebo zalievaním. Formy použitia závisia od účelu použitia, v každom prípade by sa však malo zabezpečiť čo možno najjemnejšie rozdelenie účinných zlúčenín podľa vynálezu.

Herbicídne kompozície obsahujú herbicídne účinné množstvo najmenej jednej zlúčeniny vzorca I alebo poľnohospodársky využiteľné soli zlúčeniny vzorca I, a pomocné látky, ktoré sa zvyčajne používajú pri úprave prípravkov na ochranu rastlín.

Vo všeobecnosti vhodné inertné pomocné látky zahrňujú: frakcie minerálnych olejov so strednou alebo vysokou teplotou varu, ako je petrolej a motorová nafta, ďalej čiernouhoľné dechtové oleje a oleje rastlinného alebo živočíšneho pôvodu, alifatické, cyklické a aromatické uhľovodíky, napríklad parafíny, tetrahydronaftalén, alkylované naftalény a ich deriváty, alkylované benzény a ich deriváty, alkoholy, ako je metanol, etanol, propanol, butanol a cyklohexanol, ketóny, ako je cyklohexanón, alebo silné polárne rozpúšťadlá, napríklad amíny, ako je N-metylpyrolidón a voda.

Vodné aplikačné formy sa môžu pripraviť z emulzných koncentrátov, suspenzií, pást, zmáčateľných práškov alebo vo vode dispergovateľných granulátov pridaním vody. Na prípravu emulzií, pást alebo olejových disperzií sa herbicídna zmes, samotná alebo rozpustená v oleji alebo v rozpúšťadle, môže homogenizovať vo vode s použitím zmáčacích činidiel, zahusťovadiel, dispergačných činidiel alebo emulgačných činidiel. Alternatívne sa však môžu tiež pripraviť tiež koncentráty pozostávajúce z účinnej látky, zmáčacieho činidla, zahusťovadla, dispergačného činidla alebo emulgačného činidla a prípadne rozpúšťadla alebo oleja, a tieto koncentráty sú vhodné na riedenie vodou.

Vhodnými povrchovo aktívnymi látkami sú soli alkalických kovov, soli kovov alkalických zemín a amónne soli aromatických sulfónových kyselín, napríklad kyseliny lignínsulfónovej, kyseliny fenolsulfónovej, kyseliny naftalénsulfónovej a kyseliny dibutyl-naftalénsulfónovej, a masných kyselín, alkyl- a alkylarylsulfonátov, alkylsulfátov, laurylétersulfáty a sulfáty masných alkoholov a soli sulfátovaných hexa-, hepta- a oktadekanolov a glykolétery masných alkoholov, kondenzačné produkty sulfónovaného naftalénu a jeho derivátov s formaldehydom, kondenzačné produkty naftalénu alebo naftalénsulfónových kyselín s fenolom a formaldehydom, polyoxyetylén-oktylfenyléter, etoxylovaný izooktyl-, oktyl- alebo nonylfenol, alkylfenyl- a tributylfenyl-polyglykolétery, alkylaryl-polyéteralkoholy, izotridecyl-alkohol, kondenzačné produkty masných alkoholov s etylénoxidom, etoxylovaný ricínový olej, polyoxyetylénalkylétery alebo polyoxypropylénalkylétery, lauryl-alkoholpolyglykoléteracetát, sorbitolestery, lignínsulfitové výluhy alebo metylcelulóza.

Práškovité, posypové alebo poprašovacie prostriedky sa môžu pripraviť zmiešaním alebo spoločným rozomieľaním účinných zlúčenín s pevným nosičom.

Granuláty, napríklad obalované granuláty, impregnované granuláty a homogénne granuláty, sa môžu pripraviť naviazaním účinných zložiek na pevné nosiče. Pevnými nosičmi sú minerálne hlinky, ako sú kremeliny, silikagély, kremičitany, mastenec, kaolín, vápenec, vápno, krieda, bolus, spraš, íl, dolomit, diatomhlinka, síran vápenatý, síran horečnatý, oxid horečnatý, mleté syntetické materiály, hnojivá, ako je síran amónny, fosforečnan amónny, dusičnan amónny, močoviny a produkty rastlinného pôvodu, ako je obilná múčka, múčka zo stromovej kôry, drevná múčka a múčka z orechových škrupín, prášková celulóza alebo ďalšie pevné nosiče.

Koncentrácie zlúčenín vzorca I v prípravkoch na priame použitie sa môžu meniť v širokom rozmedzí. Vo všeobecnosti prípravky obsahujú od približne 0,001 do 98 % hmotnostných, výhodne 0,01 až 95 % hmotnostných, najmenej jednej účinnej zlúčeniny. Účinné zlúčeniny sa použijú v čistote od 90 % do 100 %, výhodne 95 % až 100 % (podľa NMR spektra).

Prípravu takýchto prípravkov ilustrujú nasledujúce príklady prípravy:

- I. 20 dielov hmotnostných zlúčeniny č. 2.2 sa rozpustilo v zmesi pozostávajúcej z 80 dielov hmotnostných alkylovaného benzénu, 10 dielov hmotnostných aduktu 8 až 10 mol etylénoxidu ku 1 mol N-monoetanolamidu kyseliny olejovej, 5 dielov hmotnostných dodecylbenzénsulfonátu vápenatého a 5 dielov hmotnostných aduktu 40 mol etylénoxidu ku 1 mol ricínového oleja. Vliatím roztoku do 100 000 dielov hmotnostných vody a jeho jemnou distribúciou sa získa vodná disperzia, ktorá obsahuje 0,02 % hmotnostných účinnej zlúčeniny.
- II. 20 dielov hmotnostných zlúčeniny č. 2.8 sa rozpustilo v zmesi pozostávajúcej zo 40 dielov hmotnostných cyklohexanónu, 30 dielov hmotnostných izobutanolu, 20 dielov hmotnostných aduktu 7 mol etylénoxidu ku 1 mol izooktylfenolu a 10 dielov hmotnostných aduktu 40 mol etylénoxidu ku 1 mol ricínového oleja. Vliatím roztoku do 100 000 dielov hmotnostných vody a jeho jemnou distribúciou sa získa vodná disperzia, ktorá obsahuje 0,02 % hmotnostných účinnej zlúčeniny.
- III. 20 dielov hmotnostných účinnej zlúčeniny č. 2.8 sa rozpustilo v zmesi pozostávajúcej z 25 dielov hmotnostných cyklohexanónu, 65 dielov hmotnostných frakcie minerálneho oleja s teplotou varu 210 až 280 °C a 10 dielov hmotnostných aduktu 40 mol etylénoxidu ku 1 mol ricínového oleja. Vliatím roztoku do 100 000 dielov hmotnostných vody a jeho jemnou distribúciou sa získa vodná disperzia, ktorá obsahuje 0,02 % hmotnostných účinnej zlúčeniny.
- IV. 20 dielov hmotnostných účinnej č. 2.2 sa dôkladne zmiešalo s 3 dielmi hmotnostnými diizobutylnaftalénsulfonátu sodného, 17 dielmi hmotnostnými sodnej soli lignínsulfónovej kyseliny zo sulfitových výluhov a 60 dielmi hmotnostnými práškového silikagélu a zmes sa zomlela na kladivkovom mlyne. Jemnou distribúciou zmesi v 20 000 dieloch hmotnostných vody sa získa postreková zmes, ktorá obsahuje 0,1 % hmotnostné účinnej zlúčeniny.

- V. 3 diely hmotnostné účinnej zlúčeniny č. 2.8 sa zmiešalo s 97 dielmi hmotnostnými jemne zomletého kaolínu. Takto sa získa poprašovací prostriedok, ktorý obsahuje 3 % hmotnostné účinnej zlúčeniny.
- VI. 20 dielov hmotnostných účinnej zlúčeniny č. 2.2 sa dôkladne zmiešalo s 2 dielmi hmotnostnými dodecylbenzénsulfonátu vápenatého, 8 dielmi hmotnostnými polyglykoléteri mastných kyselín, 2 dielmi hmotnostnými sodnej soli kondenzačného produktu fenol/močovina/formaldehyd a 68 dielmi hmotnostných parafínového minerálneho oleja. Takto sa získa stabilná olejová disperzia.
- VII. 1 diel hmotnostný účinnej zlúčeniny č. 2.8 sa rozpustilo v zmesi pozostávajúcej zo 70 dielov hmotnostných cyklohexanónu, 20 dielov hmotnostných etoxylovaného izooktylfenolu a 10 dielov hmotnostných etoxylovaného ricínového oleja. Takto sa získa stabilný emulzný koncentrát.
- VIII. 1 diel hmotnostný účinnej zlúčeniny č. 2.2 sa rozpustil v zmesi pozostávajúcej z 80 dielov hmotnostných cyklohexanónu a 20 dielov hmotnostných prípravku Wettol® EM 31 (= neiónový emulgátor na báze etoxylovaného ricínového oleja). Takto sa získa stabilný emulzný koncentrát.

Herbicídne kompozície alebo zlúčeniny vzorca I sa môžu aplikovať pre- alebo post-emergentne. Ak sú účinné zlúčeniny menej tolerované určitými poľnohospodárskymi plodinami, môžu sa použiť aplikačné techniky, pri ktorých sa herbicídne kompozície rozstrekujú, pomocou postrekovacieho zariadenia, takým spôsobom, že prichádzajú do čo najmenšieho kontaktu, ako vôbec prídu do kontaktu, s listami citlivých poľnohospodárskych plodín, zatiaľ čo účinné zlúčeniny zasiahnu listy pod nimi rastúcich nežiadúcich rastlín alebo nezarastený povrch pôdy.

Aplikačné dávky zlúčenín vzorca I predstavujú od 0,001 do 3,0 kg/ha, výhodne 0,01 až 1,0 kg/ha účinnej látky, v závislosti od cieľa ničenia, obdobia, cielených rastlín a štádia rastu.

Na dosiahnutie spektra aktivity a dosiahnutia synergických účinkov sa 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I môžu zmiešať s veľkým počtom reprezentantov iných skupín herbicídne účinných zlúčenín alebo účinných zlúčenín regulujúcich rast rastlín a potom sa aplikovať spoločne. Vhodnými zložkami pre zmesi sú napríklad 1,2,4-tiadiazoly, 1,3,4-tiadiazoly, amidy, kyselina aminofosforečná a jej deriváty, aminotriazoly, anilidy, (het)aryloxyalkánové kyseliny a ich deriváty, kyselina benzoová a jej deriváty, benzotiadiazinóny, 2-(hetaroyl/aroyl)-1,3-cyklohexanedióny, hetarylarylketóny, benzylizoxazolidinóny, meta-CF₃-fenylové deriváty, karbamáty, kyselina chinolíňkarboxylová a jej deriváty, chlóracetanilidy, cyklohexenónoximéterové deriváty, diazíny, kyselina dichlórpropiónová a jej deriváty, dihydrobenzofurány, dihydrofuran-3-óny, dinitroanilíny, dinitrofenoly, difenylétery, dipyridyly, kyseliny halogénkarboxylové a ich deriváty, močoviny, 3-fenyluracily, imidazoly, imidazolinóny, N-fenyl-3,4,5,6-tetrahydroftalimidy, oxadiazoly, oxirány, fenoly, estery aryloxy- a hetaryl-oxyfenoxypropiónových kyselín, kyselina fenylactovej a jej deriváty, kyselina 2-fenylpropiónová a jej deriváty, pyrazoly, fenylpyrazoly, pyridazíny, kyselina pyridínkarboxylová a jej deriváty, pyrimidylétery, sulfónamidy, sulfonylmočoviny, triazíny, triazinóny, triazolinóny, triazolkarboxamidy a uracily.

Ďalej môže byť výhodným aplikovať zlúčeniny vzorca I, samotné alebo spoločne v kombinácii s ďalšími herbicídmi, taktiež vo forme zmesi s ďalšími prostriedkami na ochranu rastlín, napríklad spolu s prostriedkami na ničenie škodcov alebo fytopatogénnych húb alebo baktérií. Významná je tiež miešateľnosť s roztokmi minerálnych solí, ktoré sa používajú na úpravu výživy a deficitu stopových prvkov. Taktiež sa môžu pridať nefytotoxické oleje a olejové koncentráty.

Príklady použitia

Herbicídna účinnosť 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátov vzorca I sa demonštrovala v nasledujúcich skleníkových experimentoch:

Použitými kultivačnými nádobami boli črepníky z umelej hmoty, ktoré obsahovali hlinitý piesok s približne 3,0 % humusu ako substrát. Semená testovaných rastlín sa vysiali oddelene pre každý druh.

Na pre-emergentné ošetrovanie sa účinné zlúčeniny, ktoré sa suspendovali alebo emulgovali vo vode, aplikovali priamo po vysiatí pomocou trysiek s jemnou distribúciou. Nádobu sa mierne zavlažovali, aby sa podporilo klíčenie a rast a následne sa zakryli priehľadnými plastickými príklopami, až pokým sa rastliny nezakorenili. Toto zakrytie spôsobilo rovnomerné klíčenie testovaných rastlín, pokiaľ toto nebolo nepriaznivo ovplyvnené účinnými zlúčeninami.

Na post-emergentné ošetrovanie sa testované rastliny najskôr nechali vyrásť až do výšky 3 až 15 cm, v závislosti od povahy rastliny, a až potom sa ošetrili s účinnými zlúčeninami, ktoré sa suspendovali alebo emulgovali vo vode. Testované rastliny sa na tento účel vysiali buď priamo a nechali sa rásť v tých istých nádobách alebo sa najskôr nechali rásť oddelene ako sadenice a preniesli sa do testovaných nádob niekoľko dní pred ošetrovaním. Aplikčná dávka pre post-emergentné ošetrovanie predstavovala 0,25, 0,125 alebo 0,0625 kg účinnej zlúčeniny/ha.

V závislosti od druhu sa rastliny udržiavali pri teplote 10 až 25 °C alebo pri teplote 20 až 35 °C. Testované obdobie predstavovalo 2 až 4 týždne. Počas tohto obdobia sa rastliny ošetrovali a hodnotila sa ich odozva na jednotlivé ošetrovania.

Vyhodnotenie sa uskutočnilo s použitím stupnice od 0 do 100. 100 znamená, že rastliny nevyklíčili alebo znamená úplné zničenie najmenej nadzemnej časti rastlín a 0 znamená žiadne poškodenie alebo normálny priebeh rastu.

Rastlinami použitými v skleníkových experimentoch boli nasledujúce druhy:

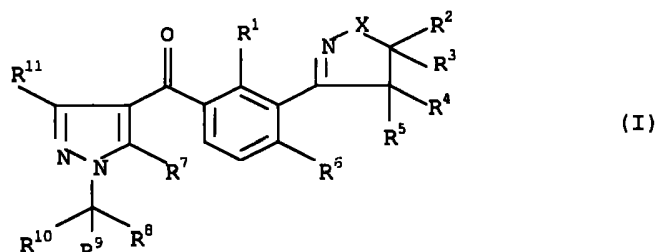
Vedecký názov	Všeobecný názov
<i>Chenopodium album</i>	Mrlík biely
<i>Echinochloa crus-galli</i>	Ježatka kuria
<i>Ipomoea ssp.</i>	Druhy pivojnice
<i>Polygonum persicaria</i>	Stavikrv broskyňolistý
<i>Setaria faberi</i>	Bar obrovský

Vedecký názov	Všeobecný názov
<i>Setaria viridis</i>	Bar zelený
<i>Sinapis alba</i>	Horčica biela
<i>Solanum nigrum</i>	Ľufok čierny

Pri aplikačných dávkach 0,25 kg/ha alebo 0,125 kg/ha zlúčenina 2.2 (Tabuľka 2) vykazovala veľmi dobrý post-emergentný účinok ako proti škodlivým trávam, ako je ježatka kuria a bar zelený, tak aj proti burinám, ako je mrlík biely, stavikrv broskyňolistý a ľufok čierny. Okrem toho vykazuje zlúčenina 2.8 (Tabuľka 2) pri vyššie uvedených podmienkach veľmi dobrý účinok proti nežiadúcim rastlinám, ako je ježatka kuria, bar obrovský, povojnica, horčica biela a ľufok čierny.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát všeobecného vzorca I



v ktorom:

- X** znamená O, NH alebo N(C₁-C₆-alkyl);
- R¹** predstavuje nitroskupinu, halogén, C₁-C₄-alkoxylovú skupinu, C₁-C₄-halogénalkoxylovú skupinu, C₁-C₄-alkyltioskupinu, C₁-C₄-halogénalkyl-tioskupinu, C₁-C₄-alkylsulfonylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkyl-sulfonylovú skupinu;
- R², R³, R⁴, R⁵** znamenajú vodík, C₁-C₄-alkylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkylovú skupinu;
- R⁶** predstavuje halogén, nitroskupinu, C₁-C₄-halogénalkylovú skupinu, C₁-C₄-alkoxylovú skupinu, C₁-C₄-halogénalkoxylovú skupinu, C₁-C₄-alkyltioskupinu, C₁-C₄-halogénalkyltioskupinu, C₁-C₄-alkylsulfonylovú skupinu alebo C₁-C₄-halogénalkylsulfonylovú skupinu;
- R⁷** znamená hydroxylovú skupinu, C₁-C₆-alkoxylovú skupinu, C₃-C₆-alkenyloxylovú skupinu, C₁-C₆-alkylsulfonyloxylovú skupinu, C₁-C₆-alkylkarbonyloxylovú skupinu, C₁-C₄-(alkyltio)karbonyloxylovú skupinu, fenyloxylovú skupinu alebo fenyloxylovú skupinu, kde fenylový zvyšok posledných dvoch uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je nitroskupina, kyanoskupina, C₁-C₄-alkylová skupina, C₁-C₄-halogénalkylová

skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina;

R⁸, R⁹ znamenajú C₁–C₄–alkylovú skupinu;

R¹⁰ predstavuje vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu; kde počet atómov uhlíka vo zvyškoch R⁸, R⁹ a R¹⁰ spoločne predstavuje najviac 7,

R¹¹ znamená vodík alebo C₁–C₄–alkylovú skupinu;

a jeho poľnohospodársky využiteľných soli.

2. 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát vzorca I podľa nároku 1, v ktorom

X znamená O;

R¹ predstavuje nitroskupinu, halogén, C₁–C₄–alkoxylovú skupinu alebo C₁–C₄–alkyltioskupinu;

R⁶ znamená C₁–C₄–alkyltioskupinu alebo C₁–C₄–alkylsulfonylovú skupinu.

3. 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát vzorca I podľa nároku 1, v ktorom

X znamená O;

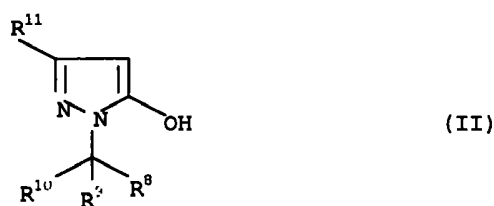
R¹ predstavuje nitroskupinu, halogén, C₁–C₄–alkoxylovú skupinu alebo C₁–C₄–alkyltioskupinu;

R⁶ znamená halogén, nitroskupinu, C₁–C₄–halogénalkylovú skupinu, C₁–C₄–alkoxylovú skupinu alebo C₁–C₄–halogénalkoxylovú skupinu.

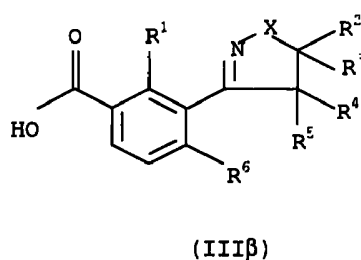
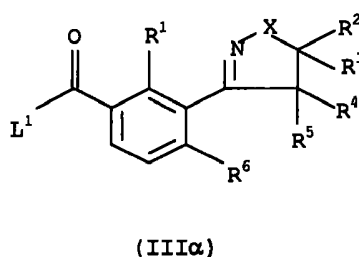
4. 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát vzorca I podľa nároku 1, v ktorom

X znamená N(C₁–C₆–alkyl).

5. Spôsob prípravy 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátov vzorca I, v ktorom R⁷ = hydroxylovú skupinu, podľa nároku 1, vyznačujúci sa tým, že zahrňuje acyláciu pyrazolu vzorca II

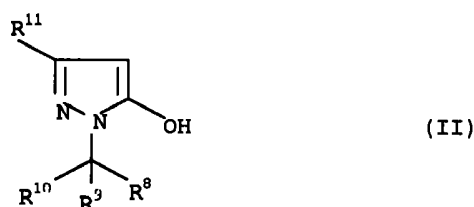


s aktivovanou kyselinou benzoovou vzorca III α alebo s kyselinou benzoovou vzorca III β ,

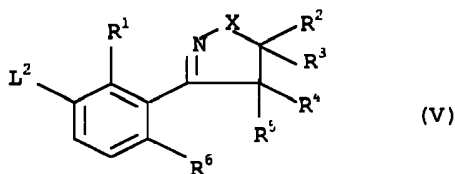


kde premenné X, R¹ až R⁶ a R⁸ až R¹¹ majú významy definované v nároku 1 a L¹ znamená nukleofilne nahraditeľnú odstupujúcu skupinu, a prešmyk acylačného produktu, v prítomnosti alebo bez prítomnosti katalyzátora, za vzniku zlúčenín vzorca I, v ktorom R⁷ = hydroxylová skupina.

6. Spôsob prípravy 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátov vzorca I, v ktorom R⁷ = OH, podľa nároku 1, vyznačujúci sa tým, že zahŕňa reakciu pyrazolu vzorca II

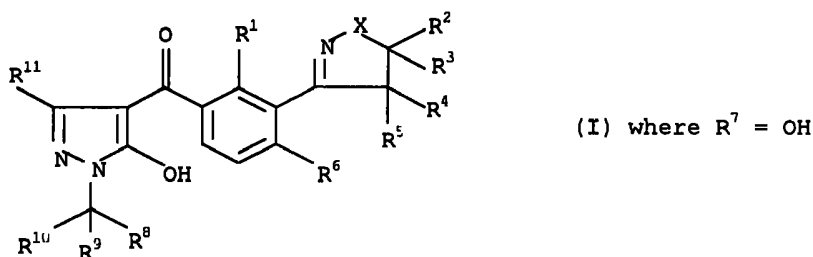


v ktorom premenné R⁸ až R¹¹ majú významy definované v nároku 1, alebo jeho alkalickéj kovovej soli s 3-(heterocyklyl)benzenénovým derivátom vzorca V



kde premenné X a R¹ až R⁶ majú významy definované v nároku 1 a L² predstavuje odstupujúcu skupinu, v prítomnosti oxidu uhoľnatého, katalyzátora a zásady.

7. Spôsob prípravy 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty vzorca I, v ktorom R⁷ ≠ hydroxylová skupina, podľa nároku 1, vyznačujúci sa tým, že zahrňuje reakciu 3-(heterocyklyl)-benzoylpyrazolového derivátu vzorca I, kde R⁷ = hydroxylová skupina



so zlúčeninou vzorca VI



kde

L³ znamená nukleofilne nahraditeľnú odstupujúcu skupinu;

R^{7a} predstavuje C₁-C₆-alkylovú skupinu, C₃-C₆-alkenylovú skupinu, C₁-C₆-alkylsulfonylovú skupinu, C₁-C₆-alkylkarbonylovú skupinu, C₁-C₄-(alkyltio)karbonylovú skupinu, fenylsulfonylovú skupinu alebo fenyلكarbonylovú skupinu, pričom fenylový zvyšok dvoch posledných uvedených substituentov môže byť čiastočne alebo úplne halogénovaný a/alebo môže niesť jednu až tri z nasledujúcich skupín, ako je: nitroskupina, kyanoskupina, C₁-C₄-alkylová skupina, C₁-C₄-

halogénalkylová skupina, C₁–C₄–alkoxylová skupina alebo C₁–C₄–halogénalkoxylová skupina.

8. Kompozícia, vyznačujúca sa tým, že obsahuje herbicídne účinné množstvo najmenej jedného 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu vzorca I alebo poľnohospodársky využiteľnej soli zlúčeniny vzorca I, podľa ktoréhokoľvek z nárokov 1 až 4, a pomocné látky, ktoré sa zvyčajne používajú na úpravu prípravkov na ochranu poľnohospodárskych plodín.
9. Spôsob prípravy kompozícií podľa nároku 8, vyznačujúci sa tým, že zahrňuje zmiešanie herbicídne účinného množstva najmenej jedného 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu vzorca I alebo poľnohospodársky využiteľnej soli zlúčeniny vzorca I, podľa ktoréhokoľvek z nárokov 1 až 4, a pomocných látok, ktoré sa zvyčajne používajú na úpravu prípravkov na ochranu poľnohospodárskych plodín.
10. Spôsob ničenia nežiadúcej vegetácie, vyznačujúci sa tým, že sa herbicídne účinné množstvo najmenej jedného 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu vzorca I alebo poľnohospodársky využiteľnej soli zlúčeniny vzorca I, podľa ktoréhokoľvek z nárokov 1 až 4, nechá pôsobiť na rastliny, miesto ich výskytu a/alebo na semená.
11. Použitie 3–(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátov vzorca I a/alebo ich poľnohospodársky využiteľných solí, podľa ktoréhokoľvek z nárokov 1 až 4, ako herbicídov.